https://trungtamthuoc.com/

Rx Thuốc này chỉ dùng theo đơn thuốc

MEDLAC
MEDLAC PHARMA ITALY CO., LTD.

HƯỚNG DẪN SỬ DỤNG
DUNG DỊCH TIÊM TRUYỀN ITAMECARDI 25

M.S.D.N: 0500594337 - C.T.T.N.H.H
CÔNG TY TNHH SẢN XUẤT DƯỢC PHẨM MEDLAC PHARMA ITALY
H. THẠCH THẤT - T.P HÀ NỘI

KHUYẾN CÁO

Đọc kỹ hướng dẫn sử dụng trước khi dùng
Để xa tầm tay trẻ em
Thuốc này chỉ dùng theo đơn thuốc
Không dùng thuốc đã biến màu, hết hạn sử dụng
Thông báo ngay cho bác sỹ hoặc dược sỹ những tác dụng không mong muốn gặp phải khi sử dụng thuốc
Muốn biết thêm thông tin xin hỏi ý kiến của bác sỹ

THÀNH PHẦN CÔNG THỨC THUỐC

Dung dịch tiêm truyền ITAMECARDI 25
Mỗi ống chứa:
Thành phần hoạt chất:
Nicardipin hydroclorid .....25,0 mg
Thành phần tá dược:
Sorbitol, natri hydroxyd, acid citric monohydrat, nước cất pha tiêm .....vừa đủ 10,0 ml
...

DẠNG BÀO CHẾ

Dung dịch tiêm truyền. Dung dịch trong suốt, màu vàng nhạt được đóng trong ống thủy tinh trung tính, màu nâu được hàn kín.

CHỈ ĐỊNH

Dung dịch tiêm truyền Nicardipin hydroclorid được chỉ định để điều trị ngắn hạn tăng huyết áp khi không điều trị được bằng đường uống. Để kiểm soát huyết áp lâu dài, chuyển sang dạng thuốc uống ngay khi tình trạng lâm sàng cho phép.

CÁCH DÙNG, LIỀU DÙNG

Thông tin chung về liều lượng

Dung dịch tiêm truyền ITAMECARDI 25 được dùng để truyền tĩnh mạch. LIỀU DÙNG KHÁC NHAU THEO TỪNG BỆNH NHÂN tùy thuộc vào mức độ nghiêm trọng của tăng huyết áp và đáp ứng của bệnh nhân trong quá trình dùng thuốc. Huyết áp và nhịp tim phải được theo dõi cả trong và sau khi truyền để tránh nhịp tim nhanh và huyết áp tâm thu hoặc huyết áp tâm trương giảm quá nhiều hoặc quá nhanh.

Chuẩn bị dung dịch truyền

Cảnh báo: Dung dịch tiêm truyền ITAMECARDI 25 cần phải được pha loãng trước khi truyền.

Dung dịch tiêm truyền nicardipin hydroclorid được dùng bằng cách truyền tĩnh mạch chậm, liên tục với nồng độ thuốc là 0,1 mg/ml. Mỗi lọ (25 mg) nên được pha loãng với 240 ml dịch truyền tĩnh mạch tương hợp (xem bên dưới) để thu được 250 ml dung dịch có nồng độ 0,1 mg/ml.

https://trungtamthuoc.com/

Dung dịch tiêm truyền nicardipin hydroclorid tương hợp và ổn định trong bình chứa làm bằng polyvinyl clorid trong 24 giờ ở nhiệt độ phòng (dưới 25°C) với:

Dịch truyền Dextrose 5%

Dịch truyền Dextrose 5% và natri clorid 0,45%

Dịch truyền Dextrose 5% và natri clorid 0,9%

Dịch truyền Natri clorid 0,45%

Dịch truyền Natrí clorid 0,9%

Dung dịch tiêm truyền nicardipin hydroclorid không tương hợp với dịch truyền Natri bicarbonat 5%, Ringer lactat.

Theo quan điểm vi sinh vật, nên sử dụng dung dịch sau khi pha ngay lập tức. Nếu chưa được sử dụng ngay, thời gian và điều kiện bảo quản trước khi sử dụng là trách nhiệm của người dùng và không nên quá 24 giờ ở nhiệt độ dưới 25°C, tránh ánh sáng, trừ khi việc pha loãng được thực hiện trong điều kiện vô trùng được kiểm soát và thẩm định

Cần kiểm tra dung dịch thuốc bằng mắt thường xem có các hạt lơ lửng hay có biến màu không. Dung dịch tiêm truyền nicardipin hydroclorid phải trong suốt và có màu vàng nhạt.

Liều dùng thay thế cho liệu pháp uống nicardipin

Tốc độ truyền tĩnh mạch cần thiết để tạo ra nồng độ trung bình trong huyết tương tương đương với liều uống ở trạng thái ổn định như sau:

Liều uống nicardipin	Tốc độ truyền tĩnh mạch tương đương
20 mg mỗi 8h	0,5 mg/giờ
30 mg mỗi 8h	1,2 mg/giờ
40 mg mỗi 8h	2,2 mg/giờ

Liều lượng cho bệnh nhân chưa dùng thuốc hạ huyết áp

Thời gian giảm huyết áp phụ thuộc vào tốc độ truyền ban đầu và tần suất điều chỉnh liều lượng. Dung dịch tiêm truyền nicardipin hydroclorid nên được truyền tĩnh mạch chậm, liên tục với nồng độ 0,1 mg /ml. Khi truyền tĩnh mạch liên tục, huyết áp bắt đầu giảm trong vòng vài phút. Huyết áp giảm khoảng 50% tổng mức giảm trong khoảng 45 phút.

Trong điều trị các đợt tăng huyết áp cấp tính ở bệnh nhân tăng huyết áp mạn tính, sau khi ngừng truyền thuốc, sẽ bù lại 50% tác dụng trong 30 ± 7 phút nhưng nồng độ thuốc trong huyết tương và giảm dần tác dụng hạ huyết áp vẫn tồn tại trong nhiều giờ.

Tốc độ truyền

Để giảm dần huyết áp, bắt đầu điều trị với tốc độ truyền 50 ml/giờ (5 mg/giờ). Nếu không đạt được mức giảm huyết áp mong muốn ở liều này, cần tăng tốc độ truyền thêm 25 ml/giờ (2,5 mg/giờ) sau mỗi 15 phút lên đến tốc độ tối đa 150 ml/giờ (15 mg/giờ), cho đến khi đạt huyết áp mong muốn. Để giảm huyết áp nhanh hơn, điều chỉnh mỗi 5 phút một lần.

Duy trì

Điều chỉnh tốc độ truyền nếu cần thiết để duy trì đáp ứng mong muốn.

Các trường hợp cần điều chỉnh tốc độ truyền tĩnh mạch

https://trungtamthuoc.com/

Hạ huyết áp hoặc nhịp tim nhanh: Trong trường hợp hạ huyết áp hoặc nhịp tim nhanh, ngừng truyền. Khi huyết áp và nhịp tim ổn định, bắt đầu truyền lại ở liều thấp như 30-50 ml/giờ (3-5 mg/giờ) và điều chỉnh để duy trì huyết áp mong muốn.

Thay đổi vị trí truyền: Thay đổi vị trí truyền sau mỗi 12 giờ nếu thuốc được truyền qua tĩnh mạch ngoại vi.

Bệnh nhân suy giảm chức năng tim, gan hoặc thận: Theo dõi chặt chẽ khi truyền nicardipin cho bệnh nhân suy tim sung huyết hoặc suy gan hoặc suy thận.

Chuyển sang các thuốc dạng uống

Nếu chuyển sang thuốc hạ huyết áp đường uống không phải là viên nang nicardipin, nên bắt đầu dùng thuốc đường uống sau khi ngừng truyền nicardipin.

Nếu chuyển sang chế độ điều trị 3 lần/ngày bằng viên nang nicardipin, dùng liều đầu tiên 1 giờ trước khi ngừng truyền.

CHỐNG CHỈ ĐỊNH

Quá mẫn với bất kỳ thành phần nào của thuốc

Hẹp van động mạch chủ nặng: Không dùng nicardipin ở bệnh nhân hẹp van động mạch chủ nặng vì tác dụng giảm hậu gánh của nicardipin. Giảm huyết áp tâm trương ở những bệnh nhân này có thể làm trầm trọng hơn thay vì cải thiện cân bằng oxy cơ tim.

CẢNH BÁO VÀ THẬN TRỌNG KHI DÙNG THUỐC

Tác dụng quá mức

Khi sử dụng nicardipin, cần theo dõi chặt chẽ huyết áp và nhịp tim. Nicardipin đôi khi có thể gây hạ huyết áp có triệu chứng hoặc nhịp tim nhanh. Tránh hạ huyết áp toàn thân khi dùng thuốc cho bệnh nhân nhồi máu não cấp tính hoặc xuất huyết.

Giảm huyết áp nhanh

Không có báo cáo lâm sàng nào cho thấy huyết áp giảm quá nhanh khi dùng nicardipin. Tuy nhiên, như các thuốc hạ huyết áp khác, việc hạ huyết áp phải được thực hiện trong một thời gian dài phù hợp với tình trạng lâm sàng của bệnh nhân.

Sử dụng ở bệnh nhân đau thắt ngực

Tần suất, thời gian hoặc mức độ nghiêm trọng của cơn đau thắt ngực tăng lên trong liệu pháp uống kéo dài bằng viên nang nicardipin.

Cơn đau thắt ngực tăng lên ít hơn 1% ở bệnh nhân có bệnh mạch vành điều trị bằng nicardipin. Cơ chế của tác động này vẫn chưa được rõ.

Sử dụng cho bệnh nhân suy tim sung huyết

Nicardipin làm giảm hậu gánh mà không làm suy giảm sức co bóp của cơ tim trong các nghiên cứu huyết động học sơ bộ trên bệnh nhân suy tim sung huyết. Tuy nhiên, trong nghiên cứu *in vitro* và ở một số bệnh nhân, hiện tượng giảm co cơ tim đã được quan sát thấy. Do đó, cần theo dõi cẩn thận các dấu hiệu sinh tồn khi sử dụng nicardipin, đặc biệt khi kết hợp với thuốc chẹn beta, ở những bệnh nhân bị suy tim sung huyết hoặc rối loạn chức năng thất trái đáng kể.

Sử dụng cho bệnh nhân suy giảm chức năng gan

Do nicardipin được chuyển hóa ở gan, nên xem xét sử dụng liều lượng thấp hơn và theo dõi chặt chẽ đáp ứng của bệnh nhân. Truyền tĩnh mạch nicardipin làm tăng dần áp lực tĩnh mạch gan thêm 4 mmHg ở bệnh nhân xơ gan dùng liều cao (5 mg/20 phút) trong một nghiên cứu. Thận trọng khi dùng cho bệnh nhân tăng áp lực tĩnh mạch cửa.

Sử dụng cho bệnh nhân suy giảm chức năng thận

Khi dùng nicardipin cho bệnh nhân tăng huyết áp nhẹ đến trung bình có suy thận mức độ trung bình, độ thanh thải toàn thân thấp hơn đáng kể và AUC cao hơn. Kết quả này tương tự ở những

https://trungtamthuoc.com/

bệnh nhân dùng nicardipin đường uống. Cần điều chỉnh liều thận trọng cho những bệnh nhân suy thận trung bình đến suy thận nặng.

Vị trí truyền thuốc qua tĩnh mạch ngoại vi

Để giảm thiểu nguy cơ kích ứng tĩnh mạch ngoại vi, xem xét thay đổi vị trí truyền thuốc sau mỗi 12 giờ.

Vị trí truyền thuốc qua tĩnh mạch trung tâm

Để giảm khả năng hình thành huyết khối tĩnh mạch, viêm tĩnh mạch, kích ứng cục bộ, sưng tấy, thoát mạch và trong trường hợp hiếm gây suy mạch máu, sử dụng thuốc qua tĩnh mạch trung tâm thay vì động mạch hoặc tĩnh mạch ngoại vi nhỏ như trên lưng bàn tay hoặc cổ tay.

Ngừng thuốc chẹn beta

Nicardipin không phải là thuốc chẹn beta, do đó không có tác dụng bảo vệ khỏi những nguy cơ khi ngừng thuốc chẹn beta đột ngột. Cần ngừng các thuốc chẹn beta từ từ.

Sử dụng cho bệnh nhân u tủy thượng thận

Chỉ có một số dữ liệu lâm sàng hạn chế về việc sử dụng nicardipin cho bệnh nhân tăng huyết áp do u tủy thượng thận.

Sử dụng cho trẻ em

Chưa xác định được tính an toàn và hiệu quả ở bệnh nhân dưới 18 tuổi.

Sử dụng cho người cao tuổi

Dược động học ở trạng thái ổn định của nicardipin ở bệnh nhân cao tuổi tăng huyết áp (> 65 tuổi) và người trưởng thành khỏe mạnh trẻ tuổi hơn là tương tự.

Các nghiên cứu lâm sàng về nicardipin không có đủ số lượng bệnh nhân từ 65 tuổi trở lên để so sánh đáp ứng với các đối tượng trẻ hơn. Các nghiên cứu lâm sàng khác cho thấy không có sự khác biệt về đáp ứng giữa bệnh nhân cao tuổi và bệnh nhân trẻ tuổi hơn. Nói chung, việc lựa chọn liều cho bệnh nhân cao tuổi nên thận trọng, thường bắt đầu ở cuối khoảng liều thấp, do tần suất người cao tuổi bị suy giảm chức năng gan, thận hoặc tim cao hơn và đang điều trị các bệnh khác.

Một ống dung dịch tiêm truyền ITAMECARDI 25 có chứa ít hơn 1 mmol natri nên có thể coi như không chứa muối natri.

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

Phụ nữ có thai

Không có nghiên cứu đầy đủ và rõ ràng về việc sử dụng nicardipin ở phụ nữ có thai. Có rất ít dữ liệu nghiên cứu trên người ở phụ nữ mang thai bị tiền sản giật và chuyển dạ sớm. Trong các nghiên cứu về độc tính sinh sản và phát triển của động vật, bằng chứng về tổn hại thai nhi đã được quan sát thấy. Do đó, chỉ sử dụng nicardipin trong thời kỳ mang thai nếu lợi ích cao hơn nguy cơ đối với thai nhi.

Trong các nghiên cứu về sinh sản được thực hiện trên chuột và thỏ, tỷ lệ chết phôi xảy ra khi nicardipin được truyền tĩnh mạch với liều tương đương với liều tiêm truyền mạch cho người là 1,6 mg/kg/ngày (chuột) và 0,32 mg/kg/ngày (thỏ).

Tỷ lệ chết phôi cũng tăng khi nicardipin được dùng bằng đường uống cho thỏ mang thai với liều tương đương với liều uống 48 mg/kg/ngày cho người (liều cao gấp 24 lần liều uống tối đa được khuyến cáo cho người và một liều liên quan đến sự ức chế tăng cân rõ rệt của cơ thể người mẹ). Ở liều uống thấp hơn, tương đương với liều 32 mg/kg/ngày cho người (cao gấp 16 lần liều uống tối đa được khuyến cáo cho người), ở một dòng thỏ khác, không có tác dụng phụ nào đối với thai nhi, mặc dù tỷ lệ tử vong của thỏ mẹ cao hơn. Không có bằng chứng về khả năng gây chết phôi hoặc gây quái thai khi chuột mang thai được sử dụng nicardipin đường uống với liều tương đương với liều uống 16 mg/kg/ngày cho người (cao gấp 8 lần liều uống tối đa được khuyến cáo cho người); tuy nhiên, tình trạng khó sinh, giảm trọng lượng chuột con, giảm tỷ lệ sống và giảm tăng cân của chuột con đã được báo cáo.

Phụ nữ cho con bú

https://trungtamthuoc.com/

Nicardipin được bài tiết rất ít vào sữa mẹ. Trong số 18 trẻ sơ sinh phơi nhiễm với nicardipin qua sữa mẹ trong thời kỳ hậu sản, liều dùng của trẻ sơ sinh được tính toán là dưới 0,3 mcg/ngày và không có tác dụng phụ nào được quan sát thấy. Khuyến cáo phụ nữ muốn cho con bú không nên dùng thuốc này.

Trong một nghiên cứu trên 11 phụ nữ sử dụng nicardipin từ 4 đến 14 ngày sau khi sinh, 4 phụ nữ uống nicardipin giải phóng nhanh 40-80 mg/ngày, 6 phụ nữ uống nicardipin giải phóng kéo dài 100-150 mg/ngày và một người được truyền tĩnh mạch 120 mg/ngày. Nồng độ cao nhất trong sữa là 7,3 µg/L (khoảng 1,9-18,8) và nồng độ trung bình trong sữa là 4,4 µg/L (khoảng 1,3-13,8). Liều lượng trẻ sơ sinh nhận được trung bình bằng 0,073% liều uống của người mẹ đã điều chỉnh theo cân nặng và bằng 0,14% liều truyền tĩnh mạch của người mẹ đã điều chỉnh theo cân nặng.

Trong một nghiên cứu khác trên 7 phụ nữ được truyền tĩnh mạch nicardipin trong thời gian trung bình 1,9 ngày ngay sau khi sinh như một liệu pháp điều trị tiền sản giật, 34 mẫu sữa được lấy vào những thời điểm không xác định và không phát hiện được nicardipin (<5 µg/L) trong 82% các mẫu sữa. Bốn phụ nữ dùng 1-6,5 mg nicardipin/giờ có 6 mẫu sữa có nồng độ nicardipin có thể phát hiện được (khoảng 5,1 đến 18,5 µg/L). Nồng độ cao nhất 18,5 µg/L được tìm thấy ở một phụ nữ dùng 5,5 mg/giờ nicardipin.

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

Chưa có bằng chứng về ảnh hưởng của thuốc lên khả năng lái xe, vận hành máy móc.

TƯƠNG TÁC, TƯƠNG KỴ CỦA THUỐC

Các thuốc hạ huyết áp

Vì dung dịch tiêm truyền nicardipin hydroclorid có thể được dùng cho những bệnh nhân đang được điều trị bằng các thuốc khác, kể cả các thuốc hạ huyết áp khác, nên cần theo dõi cẩn thận những bệnh nhân này để phát hiện và điều trị kịp thời những tác dụng không mong muốn khi dùng đồng thời.

Các thuốc chẹn beta

Ở hầu hết bệnh nhân, nicardipin có thể được sử dụng đồng thời với thuốc chẹn beta một cách an toàn. Tuy nhiên, cần thận trọng theo dõi phản ứng khi kết hợp nicardipin truyền tĩnh mạch với thuốc chẹn beta trong điều trị cho bệnh nhân suy tim sung huyết.

Cimetidin

Cimetidin đã được chứng minh là làm tăng nồng độ nicardipin trong huyết tương khi dùng cùng với nicardipin đường uống. Thận trọng theo dõi bệnh nhân dùng đồng thời hai loại thuốc trên. Dữ liệu về các thuốc kháng histamin thế hệ 2 khác không có sẵn.

Digoxin

Các nghiên cứu đã cho thấy thuốc uống nicardipin thường không làm thay đổi nồng độ digoxin trong huyết tương.

Cyclosporin

Dùng đồng thời thuốc uống nicardipin và cyclosporin làm tăng nồng độ cyclosporin trong huyết tương. Theo dõi chặt chẽ nồng độ cyclosporin trong huyết tương khi truyền tĩnh mạch nicardipin hydroclorid, và điều chỉnh liều cyclosporin cho phù hợp.

Tương tác *In vitro*

Liên kết với protein huyết tương của nicardipin không thay đổi khi thêm các thuốc furosemid, propranolol, dipyridamol, warfarin, quinidin hoặc naproxen ở nồng độ điều trị vào huyết tương người trong ống nghiệm.

Tương kỵ

Do chưa có nghiên cứu đầy đủ về tính tương kỵ của thuốc, không trộn lẫn thuốc này với các thuốc khác

https://trungtamthuoc.com/

TÁC DỤNG KHÔNG MONG MUỐN CỦA THUỐC (ADR)

Các tác dụng không mong muốn được ghi nhận trong thử nghiệm lâm sàng:

240 bệnh nhân đã tham gia vào hai thử nghiệm đa trung tâm, mù đôi, có đối chứng với giả dược của nicardipin. Các phản ứng bất lợi nói chung không nghiêm trọng và hầu hết là kết quả của việc giãn mạch. Đôi khi cần điều chỉnh liều lượng vì các phản ứng có hại. Khoảng 12% bệnh nhân phải ngừng điều trị, chủ yếu do hạ huyết áp, đau đầu và nhịp tim nhanh. Các phản ứng không mong muốn xảy ra với nicardipin nhiều hơn so với giả dược ít nhất 2% là nhức đầu (13%) và buồn nôn/nôn (4%).

Các phản ứng có hại sau đây đã được báo cáo trong các thử nghiệm lâm sàng hoặc trong y văn khi sử dụng nicardipin đường tĩnh mạch.

Toàn thân: sốt, đau cổ

Tim mạch: cơn đau thắt ngực, blốc nhĩ thất, đoạn ST chênh xuống, sóng T ngược, viêm tắc tĩnh mạch sâu.

Tiêu hóa: khó tiêu

Máu và bạch huyết: giảm tiểu cầu

Chuyển hóa và dinh dưỡng: giảm phosphat máu, phù ngoại vi

Thần kinh: lú lẫn, tăng trương lực cơ

Hô hấp: rối loạn hô hấp

Các giác quan: viêm kết mạc, rối loạn tai, ù tai

Tiết niệu: Tiểu nhiều

Rối loạn chức năng nút xoang và nhồi máu cơ tim, có thể do tiến triển của bệnh, đã được thấy ở những bệnh nhân mạn tính đang điều trị bằng nicardipin đường uống.

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

QUÁ LIỀU VÀ CÁCH XỬ TRÍ

Một số trường hợp quá liều với nicardipin dùng đường uống đã được báo cáo. Một bệnh nhân người lớn được cho là đã uống 600 mg nicardipin từ viên nang giải phóng nhanh, và một bệnh nhân khác, 2160 mg nicardipin từ dạng giải phóng kéo dài. Các triệu chứng bao gồm hạ huyết áp rõ rệt, nhịp tim chậm, đánh trống ngực, đỏ bừng, buồn ngủ, lú lẫn và nói lắp. Tất cả các triệu chứng trên đã được xử lý mà không để lại di chứng.

Quá liều đã xảy ra ở một đứa trẻ một tuổi đã ăn một nửa lượng bột trong viên nang 30 mg nicardipin. Đứa trẻ không có triệu chứng gì.

Dựa trên kết quả thu được trên động vật thí nghiệm, quá liều gây chết có thể gây hạ huyết áp toàn thân, nhịp tim chậm (sau nhịp tim nhanh ban đầu) và blốc dẫn truyền nhĩ thất tiến triển. Các bất thường chức năng gan có thể hồi phục và hoại tử gan khu trú rải rác đã được ghi nhận ở một số loài động vật dùng nicardipin liều rất lớn.

Để điều trị quá liều, nên thực hiện các biện pháp tiêu chuẩn bao gồm theo dõi các chức năng tim và hô hấp. Bệnh nhân nên tránh tư thế có thể gây thiếu oxy não. Cần đo huyết áp bệnh nhân thường xuyên. Thuốc làm tăng huyết áp được chỉ định trên lâm sàng cho những bệnh nhân có biểu hiện hạ huyết áp sâu. Dung dịch truyền tĩnh mạch calci gluconat có thể giúp đảo ngược tác dụng chẹn kênh calci của thuốc.

ĐẶC TÍNH DƯỢC LỰC HỌC

Loại thuốc: Thuốc chẹn kênh calci chọn lọc tác động lên thành mạch.

Mã ATC: C08CA04

Cơ chế hoạt động

Nicardipin ức chế dòng ion calci đi qua màng tế bào cơ tim và cơ trơn mà không làm thay đổi nồng độ calci trong huyết thanh. Quá trình co bóp của cơ tim và cơ trơn mạch máu phụ thuộc vào dòng di chuyển của các ion calci ngoại bào vào các tế bào này thông qua các kênh ion đặc hiệu.

https://trungtamthuoc.com/

Tác dụng của nicardipin chọn lọc trên cơ trơn mạch máu hơn trên cơ tim. Trên các mô hình động vật, nicardipin làm giãn cơ trơn mạch vành ở nồng độ thuốc ít hoặc không gây tác dụng giảm co cơ tim.

Dược lực học

Huyết động học

Nicardipin làm giảm sức cản hệ thống mạch máu đáng kể. Trong một nghiên cứu về nicardipin tiêm trong động mạch, mức độ giãn mạch và mức độ hạ huyết áp ở những bệnh nhân tăng huyết áp cao hơn ở những người tình nguyện có huyết áp bình thường. Sử dụng nicardipin cho người tình nguyện có huyết áp bình thường với liều từ 0,25 đến 3 mg/giờ trong 8 giờ tạo ra những thay đổi <5 mmHg trong huyết áp tâm thu và <3 mmHg trong huyết áp tâm trương.

Nhịp tim tăng là một phản ứng bình thường khi có giãn mạch và giảm huyết áp; ở một số bệnh nhân, nhịp tim tăng lên có thể rõ rệt. Trong các thử nghiệm có đối chứng với giả dược, nhịp tim tăng trung bình là 7 ± 1 bpm ở bệnh nhân sau phẫu thuật và 8 ± 1 bpm ở bệnh nhân tăng huyết áp nặng vào cuối thời gian điều trị duy trì.

Các nghiên cứu huyết động học sau khi dùng liều tĩnh mạch ở bệnh nhân bệnh mạch vành và có chức năng thất trái bình thường hoặc rối loạn trung bình cho thấy phân suất tống máu thất trái và cung lượng tim tăng đáng kể mà không có sự thay đổi rõ rệt hoặc giảm nhẹ áp lực cuối tâm trương thất trái (LVEDP). Có bằng chứng cho thấy nicardipin làm tăng lưu lượng máu. Sự co giãn mạch vành do tác dụng của nicardipin giúp cải thiện sự tưới máu và chuyển hóa hiếu khí ở những vùng bị thiếu máu cục bộ mãn tính, dẫn đến giảm sản xuất lactat và tăng cường tiêu thụ oxy. Ở những bệnh nhân bị bệnh mạch vành, nicardipin được dùng sau khi dùng thuốc chẹn beta, cải thiện đáng kể chức năng tâm thất trái cả tâm thu và tâm trương.

Ở những bệnh nhân suy tim sung huyết có suy giảm chức năng thất trái, nicardipin làm tăng cung lượng tim cả khi nghỉ ngơi và khi vận động. Giảm áp lực cuối tâm trương thất trái cũng được quan sát thấy. Tuy nhiên, ở một số bệnh nhân bị rối loạn chức năng thất trái nghiêm trọng, nicardipin có thể có tác dụng giảm co cơ tim và có thể làm tình trạng trầm trọng hơn.

"Hội chứng cắp máu mạch vành" đã không được quan sát thấy trong khi điều trị với nicardipin (Cắp máu mạch vành là sự phân phối lại không có lợi của lưu lượng máu mạch vành ở những bệnh nhân bị bệnh động mạch vành từ những vùng được tưới máu kém sang những vùng được tưới máu tốt hơn). Nicardipin đã được chứng minh là cải thiện sự rút ngắn tâm thu ở cả phân đoạn bình thường và phân đoạn giảm động của cơ tim. Chụp X quang mạch máu đã xác nhận rằng chuyển động của thành mạch vẫn được cải thiện khi nhu cầu oxy tăng lên. (Các bệnh nhân thỉnh thoảng bị đau thắt ngực tăng lên khi dùng viên nang nicardipin. Điều này cho thấy hiện tượng cắp máu mạch vành ở những bệnh nhân này, hay là kết quả của tăng nhịp tim và giảm huyết áp tâm trương, vẫn chưa rõ ràng).

Ở những bệnh nhân bị bệnh động mạch vành, nicardipin cải thiện tình trạng mất bù tâm trương thất trái trong giai đoạn máu đổ đầy sớm, có thể là do tốc độ giãn cơ tim nhanh hơn ở những vùng trước đó được tưới máu kém. Có rất ít hoặc không ảnh hưởng đến cơ tim bình thường, cho thấy sự cải thiện chủ yếu bằng các cơ chế gián tiếp như giảm hậu gánh và giảm thiếu máu cục bộ. Nicardipin không có tác dụng tiêu cực đối với việc giãn cơ tim ở liều điều trị. Lợi ích lâm sàng của các đặc tính này vẫn chưa được chứng minh.

Hiệu ứng điện sinh lý

Nói chung, không có tác dụng bất lợi nào trên hệ thống dẫn truyền tim khi dùng nicardipin. Trong các nghiên cứu điện sinh lý cấp tính, nó làm tăng nhịp tim và kéo dài khoảng QT đã điều chỉnh ở mức độ nhỏ. Nó không ảnh hưởng đến sự phục hồi nút xoang hoặc thời gian dẫn truyền SA. Các khoảng PA, AH và HV hoặc các khoảng thời gian chịu tác dụng và hiệu quả của tâm nhĩ không kéo dài. Thời gian chịu tác dụng tương đối và hiệu quả của hệ thống His-Purkinje đã được rút ngắn một chút.

https://trungtamthuoc.com/

* PA = thời gian dẫn truyền từ tâm nhĩ phải cao xuống thấp; AH = thời gian dẫn truyền từ tâm nhĩ phải thấp đến lệch bó His, hoặc thời gian dẫn truyền nút AV; HV = thời gian dẫn truyền qua bó His và hệ thống bó nhánh-Purkinje.

Chức năng gan

Vì nicardipin được chuyển hóa nhiều ở gan nên nồng độ trong huyết tương bị ảnh hưởng bởi những thay đổi trong chức năng gan. Trong một nghiên cứu lâm sàng với viên nang nicardipin ở bệnh nhân bị bệnh gan nặng, nồng độ thuốc trong huyết tương tăng lên và thời gian bán thải kéo dài. Kết quả tương tự cũng thu được ở những bệnh nhân bị bệnh gan khi dùng nicardipin hydroclorid trong 24 giờ với liều 0,6 mg/giờ.

Chức năng thận

Khi dùng nicardipin cho bệnh nhân tăng huyết áp mức độ nhẹ đến trung bình có suy thận mức độ trung bình, tốc độ lọc cầu thận (GFR) và hiệu quả lưu lượng huyết tương thận (RPF) giảm đáng kể. Không có sự khác biệt đáng kể về lưu lượng máu qua gan ở những bệnh nhân này. Độ thanh thải toàn thân thấp hơn đáng kể và diện tích dưới đường cong (AUC) cao hơn.

Khi dùng viên nang nicardipin (20 mg hoặc 30 mg, ba lần/ngày) cho bệnh nhân tăng huyết áp có suy giảm chức năng thận, nồng độ trung bình trong huyết tương, AUC và Cmax cao hơn khoảng hai lần so với nhóm chứng khỏe mạnh. Có sự gia tăng thoáng qua bài tiết chất điện giải, bao gồm cả natri.

Dùng liều tiêm bolus nicardipin hydroclorid (2,5 mg) cấp tính ở những người tình nguyện khỏe mạnh làm giảm huyết áp động mạch trung bình và sức cản mạch thận; tốc độ lọc cầu thận (GFR), lưu lượng huyết tương thận (RPF) và tỷ lệ lọc không thay đổi. Ở những bệnh nhân khỏe mạnh trải qua phẫu thuật bụng, truyền nicardipin hydroclorid (10 mg trong 20 phút) làm tăng GFR mà không thay đổi RPF khi so sánh với giả dược. Ở bệnh nhân đái tháo đường týp ll tăng huyết áp có bệnh thận, viên nang nicardipin (20 mg, 3 lần/ngày) không làm thay đổi RPF và GFR, nhưng làm giảm sức cản mạch thận.

Chức năng phổi

Trong hai nghiên cứu có kiểm soát tốt trên những bệnh nhân bị bệnh tắc nghẽn đường thở được điều trị bằng viên nang nicardipin, không thấy bằng chứng về sự gia tăng co thắt phế quản. Trong một trong hai nghiên cứu trên, viên nang nicardipin đã cải thiện thể tích thở ra gắng sức trong 1 giây (FEV1) và dung tích sống gắng sức (FVC) so với metoprolol. Các phản ứng có hại được báo cáo ở một số ít bệnh nhân bị hen suyễn, bệnh dị ứng hô hấp hoặc bệnh tắc nghẽn hô hấp tương tự như phản ứng ở những bệnh nhân khác được điều trị bằng viên nang nicardipin.

ĐẶC TÍNH DƯỢC ĐỘNG HỌC

Phân bố

Nồng độ nicardipin trong huyết tương tăng nhanh liên quan đến liều được thấy trong hai giờ đầu sau khi bắt đầu truyền nicardipin. Nồng độ trong huyết tương tăng với tốc độ chậm hơn nhiều sau vài giờ đầu tiên, và đạt được trạng thái ổn định ở 24 đến 48 giờ. Dược động học ở trạng thái ổn định của nicardipin ở bệnh nhân tăng huyết áp cao tuổi (> 65 tuổi) và người lớn trẻ khỏe mạnh tương tự nhau. Khi kết thúc truyền, nồng độ nicardipin giảm nhanh chóng, giảm ít nhất 50% trong hai giờ đầu sau khi truyền. Tác dụng của nicardipin trên huyết áp tương quan đáng kể với nồng độ thuốc trong huyết tương. Nicardipin liên kết với protein cao (> 95%) trong huyết tương người trong một phạm vi nồng độ rộng.

Sau khi truyền, nồng độ nicardipin trong huyết tương giảm theo cấp số nhân, với giai đoạn phân bố sớm nhanh (thời gian bán hủy α là 3 phút), giai đoạn trung gian (thời gian bán hủy ß là 45 phút) và giai đoạn cuối chậm (thời gian bán hủy γ là 14 giờ) mà chỉ có thể được phát hiện sau khi truyền trong thời gian dài. Tổng độ thanh thải trong huyết tương (Cl) là 0,4 l/giờ x kg, và thể tích phân bố biểu kiến (V_d) khi sử dụng mô hình không ngăn là 8,3 l/kg. Dược động học của nicardipin tuyến tính trong khoảng liều lượng từ 0,5 đến 40 mg/giờ.

Chuyển hóa và thải trừ

https://trungtamthuoc.com/

Nicardipin đã được chứng minh là chuyển hóa nhanh và chủ yếu ở gan. Nicardipin không kích thích hoặc ức chế sự chuyển hóa của chính nó và không kích thích hoặc ức chế các enzym ở microsom thể gan.
Sau khi dùng đồng thời một liều truyền tĩnh mạch nicardipin được đánh dấu đồng vị phóng xạ với một liều uông 30 mg mỗi 8 giờ, 49% hoạt độ phóng xạ được tìm thấy trong nước tiểu và 43% trong phân trong vòng 96 giờ. Không tìm thấy nicardipin dưới dạng không đổi trong nước tiểu.

QUY CÁCH ĐÓNG GÓI
Hộp 5 ống 10ml.
Hộp 10 ống 10ml.

BẢO QUẢN
Nơi khô, nhiệt độ dưới 30°C, tránh ánh sáng.
Dung dịch thuốc sau khi pha loãng nên được sử dụng ngay hoặc trong vòng 24 giờ nếu bảo quản ở nhiệt độ dưới 25°C, tránh ánh sáng.

HẠN DÙNG CỦA THUỐC
24 tháng kể từ ngày sản xuất.

TIÊU CHUẨN
TCCS

CƠ SỞ SẢN XUẤT THUỐC
CÔNG TY TNHH SẢN XUẤT DƯỢC PHẨM MEDLAC PHARMA ITALY
Khu công nghiệp công nghệ cao I, Khu công nghệ cao Hoà Lạc, KM29, Đại lộ Thăng Long, Xã Hạ Bằng, Huyện Thạch Thất, Hà Nội
Tel: (024) 33594104 Fax: (024) 33594105