

269191-251



45x24x100mm



95x40mm

- Pantone 7416C
- PANTONE 232
- PANTONE 336 C
- PANTONE Process Black

Rx- Thuốc này chỉ dùng theo đơn của bác sĩ

VASBLOCK[®]

Viên nén bao phim

Valsartan

THÀNH PHẦN

Mỗi viên nén bao phim VASBLOCK[®] chứa Valsartan 80mg hoặc 160mg.

Tá dược: Cellulose vi tinh thể 101, crospovidon loại A, povidon K30, colloidal silica khan, magnesi stearat, polyvinyl alcohol, titan dioxit (E171), macrogol, talc, vàng quinolin nhôm (E104).

DƯỢC LỰC HỌC

Valsartan là một thuốc đối kháng thụ thể angiotensin II (Ang II) mạnh và đặc hiệu có hoạt tính đường uống. Nó tác động một cách chọn lọc lên thụ thể loại AT₁, là thụ thể chịu trách nhiệm đối với các tác dụng đã biết của angiotensin II. Nồng độ của angiotensin II trong huyết tương tăng lên sau khi thụ thể AT₁ bị ức chế bởi valsartan có thể kích thích thụ thể AT₂ không bị ức chế, điều này làm cân bằng tác dụng của thụ thể AT₁. Valsartan không cho thấy bất kỳ hoạt tính đồng vận một phần nào tại thụ thể AT₁ và có ái lực đối với thụ thể AT₁ cao hơn nhiều (gấp khoảng 20.000 lần) so với thụ thể AT₂.

Valsartan không ức chế men chuyển angiotensin (còn được gọi là kininase II), là men có tác dụng chuyển angiotensin I thành angiotensin II và thoái biến bradykinin. Vì không có tác dụng trên men chuyển angiotensin và không làm mạnh thêm tác dụng của bradykinin hay chất P, các thuốc đối kháng angiotensin II không chắc là có liên quan đến chứng ho. Trong các thử nghiệm lâm sàng mà valsartan được so sánh với một thuốc ức chế men chuyển angiotensin, tỷ lệ ho khan thấp hơn đáng kể ($P < 0,05$) ở bệnh nhân điều trị bằng valsartan (2,6%) so với bệnh nhân điều trị bằng thuốc ức chế men chuyển (7,9%). Trong một thử nghiệm lâm sàng trên các bệnh nhân có tiền sử ho khan trong khi đang điều trị bằng thuốc ức chế men chuyển, 19,5% bệnh nhân trong thử nghiệm đã dùng valsartan và 19% bệnh nhân đang dùng thuốc lợi tiểu thiazid bị ho so với 68,5% bệnh nhân điều trị bằng thuốc ức chế men chuyển ($P < 0,05$).

Valsartan không gắn vào hoặc không chặn các thụ thể hormon khác hoặc các kênh ion được biết là quan trọng trong việc điều hòa tim mạch.

DƯỢC ĐỘNG HỌC

Hấp thu

Sau khi uống viên nén valsartan, nồng độ đỉnh trong huyết tương của valsartan đạt được trong 2-4 giờ. Sinh khả dụng tuyệt đối trung bình là 23%. Thức ăn làm giảm diện tích dưới đường cong của valsartan (AUC) xuống còn khoảng 40% và giảm nồng độ đỉnh trong huyết tương (C_{max}) xuống còn khoảng 50% , mặc dù khoảng 8 giờ sau khi dùng, nồng độ valsartan trong huyết tương tương tự nhau đối với nhóm đã ăn và nhóm nhịn đói. Tuy nhiên, sự giảm về AUC không kèm theo giảm tác dụng điều trị đáng kể trên lâm sàng, vì vậy có thể dùng valsartan cùng hoặc không cùng với thức ăn.

M
1-1

Phân bố

Thể tích phân bố ở trạng thái ổn định của valsartan sau khi tiêm tĩnh mạch là khoảng 17 lít, cho thấy valsartan không được phân bố vào các mô một cách rộng rãi. Valsartan gắn kết mạnh với protein huyết tương (94-97%), chủ yếu là albumin huyết thanh.

Chuyển hóa

Valsartan chịu sự biến đổi sinh học thấp, chỉ khoảng 20% liều dùng được tìm thấy dưới dạng các chất chuyển hóa. Một chất chuyển hóa hydroxy đã được xác định trong huyết tương ở nồng độ thấp (ít hơn 10% AUC valsartan). Chất chuyển hóa này không có tác dụng dược lý.

Thải trừ

Valsartan có động học phân rã theo hàm số lũy thừa ($t_{1/2\alpha} < 1$ giờ và $t_{1/2\beta}$ khoảng 9 giờ). Valsartan bị thải trừ chủ yếu bởi sự bài tiết qua mật vào trong phân (khoảng 83% liều dùng) và bài tiết qua thận vào trong nước tiểu (khoảng 13% liều dùng), chủ yếu ở dạng không đổi. Thời gian bán hủy của valsartan là 6 giờ.

Ở bệnh nhân suy tim

Thời gian đạt được nồng độ đỉnh trung bình và thời gian bán thải của valsartan ở bệnh nhân suy tim tương tự như đã quan sát ở những người tình nguyện khỏe mạnh. Các trị số AUC và C_{max} của valsartan hầu như tăng theo tỉ lệ tương ứng với sự tăng liều khi dùng trong khoảng liều lâm sàng (40-160 mg, 2 lần/ngày). Hệ số tích lũy trung bình khoảng 1,7. Độ thanh thải biểu kiến của valsartan sau khi uống là khoảng 4,5 lít/giờ. Tuổi tác không ảnh hưởng đến độ thanh thải biểu kiến ở bệnh nhân suy tim.

Nhóm bệnh nhân đặc biệt

Người cao tuổi

Các thông số dược động học đối với valsartan ở người già cao hơn một chút so với người trẻ tuổi, tuy nhiên điều này chưa thấy có ý nghĩa nào trên lâm sàng.

Suy giảm chức năng thận

Như có thể gặp đối với một chất mà độ thanh thải thận chỉ chiếm 30% độ thanh thải huyết tương toàn phần, chưa ghi nhận sự liên quan giữa chức năng thận và mức tiếp xúc toàn thân đối với valsartan. Vì vậy không cần chỉnh liều ở bệnh nhân suy thận (độ thanh thải creatinin >10 ml/phút). Chưa có nghiên cứu được thực hiện trên bệnh nhân có độ thanh thải creatinin <10 ml/phút và bệnh nhân đang thẩm phân. Valsartan gắn kết mạnh với protein huyết tương và không chắc được loại bỏ bằng thẩm phân.

Suy gan

Khoảng 70% liều hấp thu bị thải trừ trong mật chủ yếu dưới dạng thuốc không đổi. Valsartan không trải qua bất kỳ sự biến đổi sinh học đáng kể nào. Không có sự liên quan giữa nồng độ valsartan với mức độ rối loạn chức năng gan.

CHỈ ĐỊNH

Tăng huyết áp

Điều trị tăng huyết áp.

Sau nhồi máu cơ tim

Valsartan được chỉ định để cải thiện sự sống còn sau nhồi máu cơ tim ở những bệnh nhân ổn định về lâm sàng có các dấu hiệu, triệu chứng về suy tim hoặc có rối loạn chức năng tâm thu thất trái.

Suy tim

Điều trị suy tim triệu chứng ở người lớn khi bệnh nhân không thể sử dụng các thuốc ức chế men chuyển angiotensin (ACE) hoặc như một liệu pháp hỗ trợ cho các thuốc ức chế men chuyển angiotensin khi không thể dùng thuốc chẹn beta.

LIỀU LƯỢNG VÀ CÁCH DÙNG

Liều lượng

Tăng huyết áp

Liều khởi đầu khuyến cáo là 80 mg ngày một lần. Tác dụng chống tăng huyết áp thể hiện rõ trong vòng 2 tuần và tác dụng tối đa ghi nhận được sau 4 tuần. Ở những bệnh nhân mà huyết áp không được kiểm soát thỏa đáng, có thể tăng liều hàng ngày đến 160 mg và tối đa 320 mg.

Cũng có thể dùng valsartan với các thuốc chống tăng huyết áp khác. Dùng đồng thời với thuốc lợi tiểu cũng có thể làm giảm huyết áp ở những bệnh nhân này.

Sau nhồi máu cơ tim

Ở những bệnh nhân ổn định về lâm sàng, điều trị có thể bắt đầu sớm 12 giờ sau khi bị nhồi máu cơ tim. Sau liều khởi đầu 20 mg, 2 lần/ngày, điều trị bằng valsartan nên được điều chỉnh thành 40 mg, 80 mg và 160 mg, 2 lần/ngày trong các tuần tiếp theo.

Liều đích tối đa là 160 mg, 2 lần/ngày. Nói chung, bệnh nhân được khuyến cáo đạt được mức liều 80 mg, 2 lần/ngày 2 tuần sau khi bắt đầu điều trị và liều đích tối đa đạt được sau 3 tháng, dựa trên sự dung nạp của bệnh nhân đối với valsartan. Nếu xảy ra hạ huyết áp triệu chứng hoặc rối loạn chức năng thận cần xem xét giảm liều.

Valsartan có thể dùng ở bệnh nhân đã được điều trị bằng các thuốc khác sau nhồi máu cơ tim ví dụ thuốc làm tan huyết khối, acid acetylsalicylic, thuốc chẹn beta, các statin và thuốc lợi tiểu. Không khuyến cáo sử dụng đồng thời valsartan với cả thuốc ức chế men chuyển angiotensin (ACE).

Khi đánh giá bệnh nhân bị nhồi máu cơ tim phải luôn bao gồm đánh giá chức năng thận.

Suy tim

Liều khởi đầu khuyến cáo là 40 mg, 2 lần/ngày. Ở những bệnh nhân có thể dung nạp được thuốc, liều dùng có thể lên tới 80 mg và 160 mg, 2 lần/ngày trong vòng 2 tuần.

Cần xem xét giảm liều của thuốc lợi tiểu dùng đồng thời.

Liều tối đa/ngày được dùng trong các thử nghiệm lâm sàng là 320 mg chia làm nhiều lần.

Valsartan có thể dùng phối hợp với các thuốc điều trị suy tim khác, tuy nhiên không khuyến cáo sử dụng đồng thời với cả thuốc ức chế men chuyển angiotensin (ACE) và thuốc chẹn beta.

Khi đánh giá bệnh nhân bị suy tim phải luôn bao gồm đánh giá chức năng thận.

Người lớn tuổi

Không cần điều chỉnh liều.

Suy thận

Không cần điều chỉnh liều ở bệnh nhân có hệ số thanh thải creatinin >10 ml/phút.

Suy gan

Valsartan chống chỉ định ở bệnh nhân suy gan nặng, bệnh xơ gan mật và ứ mật.

Ở bệnh nhân suy gan nhẹ đến trung bình không ứ mật, liều valsartan không nên vượt quá 80 mg.

Trẻ em:

Trẻ em cao huyết áp:

+ Trẻ em từ 6 đến 18 tuổi

Liều khởi đầu 40 mg ngày một lần ở trẻ cân nặng dưới 35 kg và 80 mg ngày một lần ở trẻ cân nặng trên 35 kg. Liều dùng có thể điều chỉnh tùy theo đáp ứng của bệnh nhân.

Không nên dùng quá liều tối đa khuyến cáo theo bảng sau:

Cân nặng	Liều tối đa khuyến cáo
≥18 kg - <35 kg	80 mg
≥35 kg - <80 kg	160 mg
≥80 kg - ≤160 kg	320 mg

+ Độ an toàn và hiệu quả của valsartan ở trẻ em từ 1 đến 6 tuổi chưa được thiết lập.

Trẻ em từ 6 đến 18 tuổi suy thận:

Độ an toàn và hiệu quả của valsartan ở trẻ em có thanh thải creatinin < 30 ml/phút và trẻ em thẩm tách máu chưa được thiết lập, vì vậy không khuyến cáo sử dụng valsartan ở những bệnh nhân này.

Không cần điều chỉnh liều ở bệnh nhân có hệ số thanh thải creatinin >30 ml/phút. Theo dõi chức năng thận và nồng độ kali huyết tương.

Trẻ em từ 6 đến 18 tuổi suy gan:

Không có kinh nghiệm lâm sàng sử dụng valsartan cho trẻ em nhẹ đến trung bình, liều valsartan không nên vượt quá 80 mg.

Trẻ em suy tim và sau nhồi máu cơ tim

Độ an toàn và hiệu quả của valsartan ở trẻ em suy tim và sau nhồi máu cơ tim chưa được thiết lập.

Cách dùng:

VASBLOCK® có thể uống cùng hoặc không cùng với bữa ăn và nên uống kèm với nước.

CHỐNG CHỈ ĐỊNH

- Được biết quá mẫn cảm với valsartan hoặc với bất kỳ tá dược nào của thuốc.
- Suy gan nặng, bệnh xơ gan mật và ứ mật.
- Tam cá nguyệt thứ hai và thứ ba của thai kỳ.

THẬN TRỌNG

Bệnh nhân suy chức năng thận

Không cần chỉnh liều đối với bệnh nhân bị suy thận. Tuy nhiên, chưa có dữ liệu về các trường hợp nặng (độ thanh thải creatinin < 10 mL/phút), vì vậy nên thận trọng.

Bệnh nhân suy gan

Không cần chỉnh liều đối với bệnh nhân bị suy gan. Valsartan hầu như được bài tiết trong mật dưới dạng không đổi, và bệnh nhân bị bệnh nghẽn mật cho thấy độ thanh thải valsartan thấp hơn. Cần thận trọng đặc biệt khi dùng valsartan cho bệnh nhân bị tắc nghẽn đường mật.

Bệnh nhân bị mất natri và/hoặc mất dịch

Ở những bệnh nhân bị mất natri và/hoặc mất dịch trầm trọng như đang điều trị với thuốc lợi tiểu liều cao, hiếm gặp hạ huyết áp triệu chứng xảy ra sau khi khởi đầu điều trị bằng valsartan. Mất natri và/hoặc mất dịch cần được điều trị trước khi bắt đầu điều trị bằng valsartan, ví dụ giảm liều thuốc lợi tiểu.

Bệnh nhân hẹp động mạch thận

Dùng valsartan trong thời gian ngắn cho 12 bệnh nhân bị tăng huyết áp do mạch máu thận thứ phát sau hẹp động mạch thận một bên không gây ra thay đổi đáng kể nào về huyết động học ở thận, creatinin huyết thanh hoặc nitơ urê máu (BUN). Tuy nhiên, vì các thuốc khác ảnh hưởng đến hệ renin-angiotensin-aldosterone (RAAS) có thể làm tăng urê máu và creatinin huyết thanh ở những bệnh nhân bị hẹp động mạch thận hai bên hoặc một bên, khuyến cáo theo dõi cả hai thông số trên như là biện pháp an toàn.

Bệnh nhân suy tim/sau nhồi máu cơ tim

Sử dụng valsartan ở những bệnh nhân bị suy tim hoặc sau nhồi máu cơ tim thường dẫn đến giảm phần nào về huyết áp, nhưng việc ngừng dùng valsartan do hạ huyết áp triệu chứng đang diễn tiến thường không cần thiết miễn là dùng liều theo đúng chỉ dẫn.

Cần thận trọng khi bắt đầu điều trị ở bệnh nhân bị suy tim hoặc sau nhồi máu cơ tim.

TƯƠNG TÁC THUỐC

Không nên phối hợp:

Lithi: Nồng độ lithi huyết thanh tăng có phục hồi và độc tính đã được báo cáo thấy khi sử dụng đồng thời lithi với các chất ức chế men chuyển. Không khuyến cáo sử dụng chung valsartan với lithi, nếu cần thiết phải phối hợp, nên theo dõi nồng độ lithi huyết thanh.

Thuốc lợi tiểu giữ kali, các thuốc bổ sung kali, các chất thay thế muối chứa kali và các chất khác có thể dẫn đến tăng kali huyết

Nếu cần thiết phải phối hợp valsartan với các thuốc ảnh hưởng đến nồng độ kali huyết, nên theo dõi nồng độ lithi huyết tương.

Thận trọng khi phối hợp:

Các thuốc kháng viêm không steroid, bao gồm thuốc ức chế chọn lọc COX-2, acid acetylsalicylic (>3 g/ngày), và các thuốc chống viêm không steroid không chọn lọc.

Sử dụng đồng thời chất đối kháng thụ thể angiotensin II với các thuốc kháng viêm không steroid có thể làm giảm hiệu quả hạ huyết áp. Ngoài ra, có thể ảnh hưởng xấu đến chức năng thận và làm tăng nồng độ kali huyết thanh. Nếu phải phối hợp, nên theo dõi

chức năng thận ngay khi bắt đầu điều trị và bệnh nhân phải uống đủ nước trong quá trình điều trị.

Các tương tác khác:

Không có tương tác lâm sàng có ý nghĩa nào được ghi nhận giữa valsartan với các thuốc sau: cimetidin, warfarin, furosemid, digoxin, atenolol, indometacin, hydrochlorothiazid, amlodipin, glibenclamid.

PHỤ NỮ MANG THAI VÀ CHO CON BÚ

Phụ nữ có thai

Nhóm thuốc đối kháng thụ thể Angiotensin II không được khuyến cáo sử dụng trong 3 tháng đầu của thai kỳ và chống chỉ định trong tam cá nguyệt thứ hai và thứ ba của thai kỳ.

Cho con bú

Chưa rõ valsartan được bài tiết vào sữa mẹ hay không. Không khuyến dùng valsartan ở bà mẹ đang cho con bú.

Khả năng sinh sản

Các nghiên cứu ở chuột cống đực và cái không hiển thị bất kỳ ảnh hưởng nào của valsartan lên khả năng sinh sản khi dùng liều lên đến 200 mg/kg/ngày. Liều này gấp 6 lần liều tối đa khuyến cáo dùng cho người tính trên mg/m^2 (tương ứng với liều uống 320 mg/ngày cho bệnh nhân 60kg).

ẢNH HƯỞNG CỦA THUỐC ĐẾN KHẢ NĂNG LÁI XE VÀ VẬN HÀNH MÁY MÓC

Chưa có các báo cáo về ảnh hưởng của thuốc lên khả năng lái xe và vận hành máy móc, tuy nhiên người sử dụng thuốc nên thận trọng khi phải lái xe và vận hành máy móc do thuốc có thể gây ra chóng mặt và mệt mỏi.

TÁC DỤNG KHÔNG MONG MUỐN

Trong các nghiên cứu lâm sàng có kiểm chứng trên bệnh nhân bị tăng huyết áp, tần suất chung bị các phản ứng phụ (ADRs) được so sánh với giả dược và phù hợp với tính chất dược lý của valsartan. Tần suất của các phản ứng phụ không liên quan đến liều dùng hoặc thời gian điều trị và cũng cho thấy không có liên quan với giới tính, tuổi tác hoặc chủng tộc.

Các phản ứng phụ được báo cáo từ các nghiên cứu lâm sàng, kinh nghiệm hậu mãi và các kết quả cận lâm sàng được liệt kê trong bảng dưới đây theo nhóm hệ thống cơ quan.

Các phản ứng phụ được xếp loại theo tần suất, đầu tiên là hay gặp nhất, sử dụng quy ước sau đây: rất hay gặp ($\geq 1/10$); hay gặp ($\geq 1/100, < 1/10$); ít gặp ($\geq 1/1.000, < 1/100$); hiếm gặp ($\geq 1/10.000, < 1/1.000$); rất hiếm gặp ($< 1/10.000$) bao gồm cả các báo cáo đơn lẻ. Với mỗi nhóm tần suất, các phản ứng phụ được xếp loại theo thứ tự độ nghiêm trọng giảm dần.

Đối với các phản ứng phụ được báo cáo từ kinh nghiệm hậu mãi và các kết quả cận lâm sàng không thể sắp xếp vào bất cứ tần suất phản ứng phụ nào và do đó chúng được đề cập với tần suất "chưa biết".

- Tăng huyết áp

<i>Rối loạn về máu và hệ bạch huyết</i>	
Chưa biết	Giảm haemoglobin, giảm tỉ lệ thể tích huyết cầu, giảm bạch cầu trung tính, giảm tiểu cầu
<i>Rối loạn về hệ miễn dịch</i>	
Chưa biết	Quá mẫn cảm bao gồm bệnh huyết thanh
<i>Rối loạn về chuyển hóa và dinh dưỡng</i>	
Chưa biết	Tăng kali huyết thanh
<i>Rối loạn về tai và mê đạo</i>	
Ít gặp	Chóng mặt
<i>Rối loạn về mạch</i>	
Chưa biết	Viêm mạch
<i>Rối loạn về hô hấp, ngực và trung thất</i>	
Ít gặp	Ho
<i>Rối loạn về dạ dày ruột</i>	
Ít gặp	Đau bụng
<i>Rối loạn về gan mật</i>	
Chưa biết	Tăng các chỉ số về chức năng gan bao gồm cả tăng bilirubin huyết thanh
<i>Rối loạn về da và mô dưới da</i>	
Chưa biết	Phù mạch, ban, ngứa
<i>Rối loạn về cơ xương và mô liên kết</i>	
Chưa biết	Đau cơ
<i>Rối loạn về thận và tiết niệu</i>	
Chưa biết	Giảm chức năng thận và suy thận, tăng creatinin huyết thanh
<i>Rối loạn toàn thân và tình trạng tại chỗ dùng thuốc</i>	
Ít gặp	Mệt mỏi

- Suy tim và/hoặc sau nhồi máu cơ tim

<i>Rối loạn về máu và hệ bạch huyết</i>	
Chưa biết	Giảm tiểu cầu
<i>Rối loạn về hệ miễn dịch</i>	
Chưa biết	Quá mẫn cảm bao gồm bệnh huyết thanh
<i>Rối loạn về chuyển hóa và dinh dưỡng</i>	
Ít gặp	Tăng kali huyết
Chưa biết	Tăng kali huyết thanh
<i>Rối loạn về hệ thần kinh</i>	
Hay gặp	Chóng mặt, chóng mặt khi thay đổi tư thế
Ít gặp	Ngất, đau đầu
<i>Rối loạn về tai và mê đạo</i>	
Ít gặp	Chóng mặt

<i>Rối loạn về tim</i>	
Ít gặp	Suy tim
<i>Rối loạn về mạch</i>	
Hay gặp	Hạ huyết áp, hạ huyết áp tư thế đứng
Chưa biết	Viêm mạch
<i>Rối loạn về hô hấp, ngực và trung thất</i>	
Ít gặp	Ho
<i>Rối loạn về dạ dày ruột</i>	
Ít gặp	Buồn nôn, tiêu chảy
<i>Rối loạn về gan mật</i>	
Chưa biết	Tăng các chỉ số về chức năng gan
<i>Rối loạn về da và mô dưới da</i>	
Ít gặp	Phù mạch
Chưa biết	Ban, ngứa
<i>Rối loạn về cơ xương và mô liên kết</i>	
Chưa biết	Đau cơ
<i>Rối loạn về thận và tiết niệu</i>	
Hay gặp	Giảm chức năng thận và suy thận
Ít gặp	Suy thận cấp, tăng creatinin huyết thanh
Chưa biết	Tăng Nitơ Urê huyết
<i>Rối loạn toàn thân và tình trạng tại chỗ dùng thuốc</i>	
Ít gặp	Suy nhược, mệt mỏi

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

QUÁ LIỀU

Quá liều với valsartan có thể gây hạ huyết áp rõ rệt, đưa đến giảm tri giác, truy tuần hoàn và/hoặc sốc. Nếu hạ huyết áp xảy ra, bệnh nhân nên được đặt ở tư thế nằm ngửa và nên xem xét việc điều chỉnh thể tích máu. Valsartan không chắc được loại bỏ bằng thẩm tách máu.

QUI CÁCH ĐÓNG GÓI: Hộp 3 vỉ x 10 viên nén bao phim.

BẢO QUẢN: Nơi khô, ở nhiệt độ dưới 30 °C, tránh ánh sáng.

HẠN DÙNG: 24 tháng kể từ ngày sản xuất.

Không dùng thuốc khi đã quá hạn sử dụng.

Đọc kỹ hướng dẫn sử dụng trước khi dùng.

Nếu cần thêm thông tin, xin hỏi ý kiến bác sỹ.

Tránh xa tầm tay trẻ em.

Sản xuất bởi MEDOCHEMIE LTD –CH Síp (Châu Âu)

Văn phòng: 1 - 10 Constantinoupoleos street, 3011 Limassol.

Nhà máy trung tâm: 1 - 10 Constantinoupoleos street, 3011 Limassol.



TU. CỤC TRƯỞNG
P. TRƯỞNG PHÒNG
Nguyễn Huy Hùng