

Rx: Thuốc kê đơn

[Thành phần] Mỗi viên chứa:

Hoạt chất:

Clopidogrel hydrogen sulfate ... 97.875 mg
(tương đương 75 mg clopidogrel)

Tá dược: Hydroxypropyl cellulose EXF, mannitol 400 DC, cellulose vi tinh thể 102, macrogol 6000 PF, dầu thầu dầu hydrogen hóa, Opadry II 31K24280 pink.

[Dạng bào chế] Viên nén bao phim

[Quy cách đóng gói] Hộp 2 vỉ, mỗi vỉ 14 viên nén bao phim.

[Chỉ định]

- Dự phòng nguyên phát các rối loạn do nghẽn mạch huyết khối như nhồi máu cơ tim, đột quỵ và bệnh động mạch ngoại biên.

- Kiểm soát và dự phòng thứ phát ở bệnh nhân xơ vữa động mạch mới bị đột quỵ, mới bị nhồi máu cơ tim hoặc bệnh động mạch ngoại biên đã xác định.

[Liều lượng và cách dùng]

- Người lớn: Viên nén bao phim Bilgrel nên dùng liều duy nhất 75 mg mỗi ngày một lần. Không cần điều chỉnh liều đối với bệnh nhân lớn tuổi và bệnh nhân bị bệnh thận.

- Trẻ em: Sự an toàn và hiệu quả chưa được xác định ở những bệnh nhân ít hơn 18 tuổi.

[Chống chỉ định]

- Các bệnh nhân mẫn cảm với bất kỳ thành phần nào của thuốc.

- Bệnh nhân đang có chảy máu bệnh lý như loét dạ dày tá tràng hoặc xuất huyết nội sọ.

[Thận trọng]

- Không dùng quá liều chỉ định trừ khi có chỉ định của bác sĩ.

- Sử dụng thận trọng cho những người có nguy cơ chảy máu tăng từ chấn thương, phẫu thuật hoặc bệnh lý khác. Nên ngưng dùng thuốc trước khi phẫu thuật 7 ngày.

- Bilgrel kéo dài thời gian chảy máu. Do đó cần thận trọng khi dùng đồng thời với các thuốc có thể gây ra các tổn thương tương tự như acid salicylic, các thuốc chống viêm không steroid.

- Bệnh nhân nên thông báo cho bác sĩ và nha sĩ rằng họ đang dùng Bilgrel trước bất kỳ phẫu thuật dự kiến và trước khi dùng bất cứ loại thuốc mới nào.

[Tác dụng phụ]

Như với tất cả các loại thuốc ảnh hưởng đến khả năng đông máu, chảy máu có thể xuất hiện do sử dụng clopidogrel. Chảy máu có thể xảy ra trong bất kỳ phần nào của cơ thể. Nguy cơ phụ thuộc vào nhiều yếu tố, bao gồm cả việc sử dụng thuốc và khả năng nhạy cảm của bệnh nhân.

- Trên 10%:

Hệ tiêu hóa: Nhìn chung, tỷ lệ tác dụng phụ trên hệ tiêu hóa (bao gồm cả đau bụng, khó tiêu, viêm dạ dày và táo bón) được ghi nhận là 27%.

- 3% - 10%:

Hệ thống tim mạch: Đau ngực (8%), phù nề (4%), tăng huyết áp (4%).

Hệ thống thần kinh trung ương: Nhức đầu (3-8%), chóng mặt (2-6%), trầm cảm (4%), mệt mỏi (3%).

Phản ứng ở da: Phát ban (4%), ngứa (3%).

Endocrin và hệ thống trao đổi chất: tăng cholesterol máu (4%).

Hệ thống tiêu hóa: Đau bụng (2-6%), khó tiêu (25%), tiêu chảy (2-5%), buồn nôn (3%).

Hệ thống sinh dục: nhiễm trùng đường tiết niệu (3%).

Hệ thống huyết học: Ban xuất huyết (5%), chảy máu cam (3%).

Hệ thống gan: rối loạn chức năng gan thử nghiệm (<3%).

Hệ thống xương: đau khớp (6%), đau lưng (6%).

Hệ hô hấp: khó thở (5%), viêm mũi (4%), viêm phế quản (4%), ho (3%), nhiễm trùng đường hô hấp trên (9%).

Loại khác: hội chứng giống như cúm (8%).

- Dưới 1%:

Phản ứng dị ứng, phù mạch, thiếu máu bất sản, co thắt phế quản, sốt, tiểu máu, ho ra máu, viêm gan, hoại tử do thiếu máu cục bộ, giảm bạch cầu, chảy máu sau phúc mạc, xuất huyết giảm tiểu cầu, nổi mề đay.

Thông báo ngay cho bác sĩ hoặc dược sĩ khi gặp phải các tác dụng phụ của thuốc.

[Tương tác thuốc]

Với acid Acetylsalicylic:

ASA không làm thay đổi khả năng ức chế ngưng tập tiểu cầu do ADP của clopidogrel, nhưng clopidogrel gia tăng hiệu quả của ASA trên sự ngưng tập tiểu cầu do collagen. Tuy nhiên, việc kết hợp 500 mg aspirin 2 lần/ngày với 75 mg clopidogrel 1 lần/ngày đã không làm tăng có ý nghĩa việc kéo dài thời gian chảy máu do dùng clopidogrel. Tương tác dược lực học giữa clopidogrel và ASA là có thể xảy ra, làm tăng nguy cơ chảy máu. Do đó, cần thận trọng khi dùng phối hợp.

Với Heparin

Trong một nghiên cứu trên người tình nguyện khỏe mạnh, Bilgrel không làm thay đổi tác dụng của heparin đối với tình trạng đông máu. Dùng đồng thời Bilgrel và heparin không có tác dụng ức chế sự kết tập tiểu cầu gây ra bởi Bilgrel. Tuy nhiên sự an toàn của sự kết hợp này chưa được xác định. Do đó, nên thận trọng khi sử dụng đồng thời.

Với Warfarin

Sự an toàn của việc sử dụng đồng thời warfarin và Bilgrel chưa được xác định. Do đó, nên thận trọng khi dùng.

Với thuốc chống viêm không steroid

Trong một nghiên cứu ở người tình nguyện khỏe mạnh, việc sử dụng đồng thời Bilgrel và naproxen đã làm tăng chảy máu đường tiêu hóa. Vì vậy, để tránh nguy cơ mất máu, NSAIDs và Bilgrel nên được dùng một cách thận trọng.





Việc sử dụng đồng thời các trị liệu khác

- Không thấy có tương tác khi sử dụng đồng thời Bilgrel với atenolol, nifedipin hoặc cả atenolol và nifedipin.

- Dược lực học của Bilgrel bị ảnh hưởng không đáng kể khi dùng chung với phenobarbital, cimetidin hoặc estrogen.

- Dược động học của theophyllin hoặc digoxin không bị ảnh hưởng khi dùng đồng thời với Bilgrel.

- Các antacid không bị ảnh hưởng mức độ hấp thu bởi Bilgrel.

- Các nghiên cứu trên microsomes gan người đã chỉ ra rằng Bilgrel ức chế sự hoạt động của một trong các enzym (CYP 2C9) của cytochrome P450 (2C9) enzym. Tình trạng này có thể dẫn đến sự gia tăng nồng độ trong huyết tương của thuốc, chẳng hạn như phenytoin và tolbutamide, được chuyển hóa bởi CYP 2C9.

- Không có bằng chứng về ý nghĩa lâm sàng tương tác bất lợi do sử dụng đồng thời Bilgrel với thuốc lợi tiểu, chẹn beta, thuốc đối kháng calci, giảm cholesterol, thuốc giãn mạch vành, thuốc điều trị đái tháo đường, thuốc chống động kinh và các nội tiết tố.

[Sử dụng thuốc cho phụ nữ có thai và cho con bú]

Phụ nữ có thai

Nghiên cứu ở chuột và thỏ cho thấy không có bằng chứng về sự suy giảm khả năng sinh sản hoặc gây độc tính do clopidogrel. Tuy nhiên, chưa có bằng chứng đầy đủ về tác động của thuốc lên phụ nữ mang thai. Bởi vì các nghiên cứu sinh sản trên động vật không tiên đoán được khả năng phản ứng của con người. Bilgrel chỉ nên được sử dụng trong thời kỳ mang thai khi thực sự cần thiết.

Phụ nữ cho con bú

Các nghiên cứu ở chuột đã cho thấy rằng clopidogrel và các chất chuyển hóa của nó được bài tiết trong sữa. Người ta không biết liệu thuốc có được bài tiết trong sữa mẹ hay không. Vì vậy, khi sử dụng thuốc nên ngừng cho con bú.

[Ảnh hưởng đến khả năng lái xe và vận hành máy móc]

Thuốc có thể gây nhức đầu, buồn ngủ, chóng mặt, mệt mỏi; gây ảnh hưởng đến khả năng lái xe, vận hành máy móc.

Không sử dụng thuốc khi vận hành máy móc, tàu xe.

[Độc tính dược lực học]

Clopidogrel là một chất ban đầu và ức chế mạnh mẽ sự kết tập tiểu cầu. Clopidogrel ức chế chọn lọc sự gắn kết của adenosine diphosphat (ADP) lên thụ thể tiểu cầu của nó và kích hoạt ADP qua trung gian tiếp theo của GPIIb/IIIa, do đó ức chế sự kết tập tiểu cầu. Chuyển dạng sinh học của clopidogrel là cần thiết để tạo ra sự ức chế kết tập tiểu cầu. Clopidogrel cũng ức chế kết tập tiểu cầu gây ra bởi các thụ thể khác hơn ADP bằng cách ngăn chặn sự khuếch đại kích hoạt tiểu cầu do ADP phát động. Clopidogrel không hạn chế hoạt động của phosphodiesterase.

Hoạt động của Clopidogrel không thể phục hồi thay đổi các thụ thể ADP tiểu cầu. Do đó, tiểu cầu tiếp xúc với clopidogrel sẽ bị ảnh hưởng phần còn lại của tuổi thọ và trở về chức năng tiểu cầu bình thường xảy ra ở tốc độ phù hợp với chu kỳ tiểu cầu (khoảng 7 ngày).

Theo thống kê, liều ức chế kết tập tiểu cầu có thể có được 2 giờ sau khi uống liều duy nhất của clopidogrel. Lặp đi lặp lại liều 75mg (clopidogrel bisulfat) mỗi ngày làm tăng đáng kể

sự ức chế kết tập tiểu cầu. Sự ức chế này tăng dần và đạt đến trạng thái ổn định giữa ngày 3 và ngày 7. Trạng thái ổn định mức độ ức chế trung bình quan sát với một liều 75mg mỗi ngày là từ 40% đến 60%. Kết tập tiểu cầu và chảy máu dần dần trở về giá trị ban đầu sau khi ngừng điều trị, thường là ở khoảng 7 ngày.

[Dược động học]

Clopidogrel được hấp thu nhanh chóng sau khi uống liều lặp lại 75mg clopidogrel (base). Hấp thu ít nhất 50% dựa trên sự bài tiết nước tiểu của chất chuyển hóa có liên quan đến clopidogrel. Clopidogrel là một tiền thuốc. Hoạt tính chính là của chất chuyển hóa của nó, một dẫn xuất thiol với quá trình oxy hóa clopidogrel thành 2-clopidogrel-oxo và thủy phân sau đó. Bước oxy hóa được quy định chủ yếu với cytochrom P450 enzym 2B6, 3A4, 1A1, 1A2 và 2C19. Chất chuyển hóa thiol liên kết với các thụ thể tiểu cầu nhanh chóng, không hồi phục và ức chế sự kết tập tiểu cầu. Chuyển hóa này không thể được xác định trong huyết tương.

Dược động học của chất chuyển hóa là tuyến tính (nồng độ trong huyết tương tăng tương ứng tỉ lệ với liều lượng thuốc đưa vào) trong phạm vi liều từ 50 đến 150mg clopidogrel.

Clopidogrel chuyển hóa ở gan, chất chuyển hóa chính là dẫn xuất acid carboxylic và nó không còn hoạt tính trên tiểu cầu. Khoảng 50% thuốc được bài tiết qua nước tiểu và khoảng 46% bài tiết qua phân. Thời gian bán thải 8h.

[Quá liều]

Biểu hiện:

Các triệu chứng của ngộ độc cấp tính bao gồm nôn mửa, khó thở và xuất huyết đường tiêu hóa.

Điều trị:

Ngưng dùng thuốc, rửa dạ dày trong vòng 4 giờ.

Điều trị triệu chứng, làm thông đường thở và cầm máu tiêu hóa.

[Bảo quản] Để nơi khô ráo, tránh ánh sáng, nhiệt độ dưới 30°C.

[Hạn dùng] 36 tháng kể từ ngày sản xuất. Không dùng thuốc khi quá hạn sử dụng.

[SDK] VN-17477-13

ĐỂ THUỐC TRÁNH XA TÀM TAY TRẺ EM.

Nhà sản xuất:

BILIM ILAC SANAYI VE TICARET A.S.

Gebze Organize Sanayi Bolgesi 1900 sokak, No:1904

41480 Gebze-Kocaeli/Thổ Nhĩ Kỳ.

12017419

