

THÔNG TIN THUỐC

Tháng 03/2019

1. Thông tin thuốc Nicorandil 5mg (Biệt dược Pecrandil)

Dược lý và cơ chế tác dụng

Cơ chế hoạt động:

Nicorandil là một este nicotinamid, là một thuốc giãn mạch với một cơ chế kép, làm **giãn cơ trơn mạch máu ở cả phần tĩnh mạch và động mạch**.

+ Hoạt hóa kênh kali \rightarrow \uparrow phân cực màng tế bào mạch máu \rightarrow giãn cơ trơn động mạch (ngoài ra sự kích hoạt của kênh kali có tác dụng tập cho cơ tim tiền thích nghi với thiếu máu cơ tim cục bộ).

+ Nhờ có nhóm citrat \rightarrow giãn cơ trơn mạch máu, đặc biệt là hệ thống tĩnh mạch thông qua sự \uparrow monophosphate guanosine vòng (cGMP) trong nội bào \rightarrow \downarrow lượng máu về tim.

Tác dụng dược lực:

+ Nicorandil ảnh hưởng trực tiếp lên động mạch vành, trên cả đoạn bình thường và đoạn hẹp, mà không có hiện tượng cướp máu động mạch vành. Việc giảm áp lực cuối tâm trương và trương lực mạch máu sẽ làm giảm kháng lực mạch máu ở các mạch ngoại biên. Cuối cùng sự cân bằng oxy trong cơ tim và lưu lượng máu đến các vùng bị hẹp của cơ tim được cải thiện.

+ Nicorandil có tác dụng chống co thắt trong cả in vivo và in vitro và đảo ngược sự co thắt mạch vành gây ra bởi methacholin hoặc noradrenalin.

+ Nicorandil không có tác dụng trực tiếp trên cơ bóp cơ tim.

Dược động học

Hấp thu và sinh khả dụng: Hấp thu nhanh và hoàn toàn qua đường tiêu hóa, không ảnh hưởng bởi thức ăn, sinh khả dụng 75%. Đạt nồng độ đỉnh trong huyết tương sau 30-60 phút.

Phân bố: toàn thân, không phụ thuộc vào liều, trong phạm vi điều trị, ít gắn kết với protein huyết tương.

Chuyển hóa: ở gan bằng cách khử nitrat thành các hợp chất không có hoạt tính trên tim.

Thải trừ: gồm 2 giai đoạn:



+ Giai đoạn thải trừ nhanh: $T_{1/2} \sim 1h$, trong đó bao gồm khoản 96% nồng độ trong huyết tương.

+ Giai đoạn thải trừ chậm: $T_{1/2} \sim 12h$, sau khi uống liều 20mg.

Nicorandil và chất chuyển hóa của nó chủ yếu được thải trừ qua đường niệu, 1 ít qua phân.

Chỉ định

Ngăn ngừa và điều trị lâu dài đau thắt ngực ổn định mãn tính.

Chống chỉ định

Bệnh nhân sốc do tim, hạ huyết áp nặng, rối loạn chức năng thất trái với áp lực làm đầy thấp hoặc mất bù tim.

Sử dụng chất ức chế 5-phosphodiesterase (sildenafil, tadalafil...) → hạ huyết áp nghiêm trọng.

Bệnh nhân giảm thể tích dịch.

Phù phổi cấp.

Liều lượng và cách dùng

+ Khởi đầu: 10mg/lần x 2 lần/ngày (hoặc 5mg x 2 lần/ngày ở bệnh nhân dễ bị đau đầu), sau đó tăng dần theo đáp ứng.

+ Liều thông thường: 10-20mg/lần x 2 lần/ngày.

+ Liều dùng nên điều chỉnh theo mức đáp ứng của bệnh nhân, có thể tăng lên đến 40mg x 2 lần/ngày nếu cần thiết.

⇒ Không khuyến cáo sử dụng cho **trẻ em và người dưới 18 tuổi**.

Tương tác

Tương tác cần thận trọng: mức độ 2

Diltiazem

Phân tích: Tăng tác dụng hạ huyết áp và tăng nguy cơ hạ huyết áp thể đứng.

Xử lý: Theo dõi huyết áp trong khi phối hợp. Tùy theo thuốc, huyết áp có thể hạ nhiều hay ít. Điều chỉnh liều của một trong hai thuốc nếu cần. Xây dựng kế hoạch dùng thuốc đều đặn. Tăng cường theo dõi ở người bệnh cao tuổi (nguy cơ ngã), và khuyến khích chuyển dần dần từ tư thế nằm hoặc ngồi sang tư thế đứng. Khuyến người bệnh gặp lại bác sĩ để điều chỉnh lại liều, nếu thấy chóng mặt khi mới dùng thuốc.

Rượu; bepridil; clonidin hoặc thuốc tương tự; dihydropyridin; furosemid hoặc thuốc tương tự; guanethidin hoặc thuốc tương tự; methyl dopa; nitrat chống đau thắt ngực; thuốc chống trầm cảm ba vòng hoặc thuốc tương tự; thuốc giãn mạch chống tăng huyết áp; thuốc lợi tiểu giữ kali; thuốc lợi tiểu thải kali; thuốc ức chế enzym chuyển; verapamil

Phân tích: Phối hợp với mọi thuốc có tính chất chống tăng huyết áp có thể làm tăng nguy cơ hạ huyết áp đôi khi dẫn tới sốc.

