

Tài liệu thông tin cho cán bộ y tế

Tenofovir STADA

300 mg

Tenofovir disoproxil fumarate 300 mg

THÀNH PHẦN: Mỗi viên nén bao phim chứa:

Tenofovir disoproxil fumarat 300 mg
Tá dược vừa đủ 1 viên

MÔ TẢ: Viên nén hình giọt nước, bao phim màu xanh, một mặt có in chữ "STADA", một mặt trơn.

DƯỢC LỰC HỌC

- Tenofovir disoproxil fumarat có cấu trúc một nucleosid phosphonat diester vòng xoắn tương tự adenosin monophosphat và có cấu trúc phân tử gần với adefovir dipivoxil. Tenofovir disoproxil fumarat cần phải trải qua sự thủy phân diester ban đầu để chuyển thành tenofovir và tiếp theo là sự phosphoryl hoá nhờ các men trong tế bào tạo thành tenofovir diphosphat. Tenofovir diphosphat ức chế hoạt tính của men sao chép ngược HIV-1 bằng cách cạnh tranh với chất nền tự nhiên deoxyadenosin-5' triphosphat và sau khi sát nhập vào DNA, kết thúc chuỗi DNA. Bên cạnh đó, tenofovir disoproxil fumarat cũng ức chế DNA polymerase của virus viêm gan B (HBV), một enzym cần thiết cho virus sao chép trong tế bào gan.

- Tenofovir diphosphat là chất ức chế yếu men và DNA polymerase của động vật có vú và men DNA polymerase ở ty thể.

DƯỢC ĐỘNG HỌC

- Sau khi uống, tenofovir disoproxil fumarat được hấp thu nhanh và chuyển thành tenofovir, với nồng độ đỉnh trong huyết tương đạt sau 1 đến 2 giờ. Sinh khả dụng thuốc ở những bệnh nhân lúc đói khoảng 25% nhưng tăng khi dùng tenofovir disoproxil fumarat với bữa ăn giàu chất béo.

- Tenofovir phân bố rộng rãi trong các mô, đặc biệt ở thận và gan. Sự gắn kết với protein huyết tương thấp hơn 1% và với protein huyết thanh khoảng 7%.

- Tenofovir disoproxil fumarat là một tiền chất dạng ester tan trong nước được biến đổi nhanh chóng trong cơ thể thành tenofovir và formaldehyd.

- Tenofovir được biến đổi trong nội bào thành tenofovir monophosphat và chất có hoạt tính tenofovir diphosphat.

- Thời gian bán thải cuối cùng của tenofovir từ 12 đến 18 giờ. Tenofovir bài tiết chủ yếu qua nước tiểu bằng cả hai cách: bài tiết chủ động qua ống thận và lọc qua cầu thận. Tenofovir được loại bằng thẩm phân máu.

CHỈ ĐỊNH

- Tenofovir disoproxil fumarat được dùng kết hợp với các thuốc kháng retrovirus khác (nhưng không nên sử dụng riêng lẻ) trong điều trị nhiễm HIV-typ 1 (HIV-1) ở người lớn.

- Tenofovir disoproxil fumarat được dùng kết hợp với các thuốc kháng retrovirus khác trong phòng ngừa nhiễm HIV sau khi đã tiếp xúc với bệnh (do nghề nghiệp hay không do nghề nghiệp) ở những cá thể có nguy cơ lây nhiễm virus.

- Tenofovir disoproxil fumarat cũng được dùng trong điều trị viêm gan siêu vi B mạn tính ở người lớn. Cũng như adefovir, tenofovir cũng có hoạt tính chống lại virus HBV đột biến để kháng với lamivudin.

LIỀU LƯỢNG VÀ CÁCH DÙNG

Tenofovir STADA 300 mg được dùng bằng đường uống một lần mỗi ngày, không bị ảnh hưởng bởi bữa ăn.

Người lớn

- **Điều trị viêm HIV:** 1 viên x 1 lần/ngày, kết hợp với các thuốc kháng retrovirus khác.

- **Dự phòng nhiễm HIV sau tiếp xúc do nguyên nhân nghề nghiệp:** 1 viên x 1 lần/ngày kết hợp với các thuốc kháng retrovirus khác (thường kết hợp với lamivudin hay emtricitabin). Dự phòng nên bắt đầu càng sớm càng tốt sau khi tiếp xúc do nguyên nhân nghề nghiệp (tốt nhất là trong vòng vài giờ hơn là vài ngày) và tiếp tục trong 4 tuần tiếp theo nếu dung nạp.

- **Dự phòng nhiễm HIV không do nguyên nhân nghề nghiệp:** 1 viên x 1 lần/ngày kết hợp với ít nhất 2 thuốc kháng retrovirus khác. Dự phòng nên bắt đầu càng sớm càng tốt sau khi tiếp xúc không do nguyên nhân nghề nghiệp (tốt nhất là trong vòng 72 giờ) và tiếp xúc trong 28 ngày.

- **Điều trị viêm gan siêu vi B mạn tính:** Liều khuyến cáo là 1 viên x 1 lần/ngày trong 48 tuần.

Bệnh nhân suy thận

- Nên thay đổi liều tenofovir disoproxil fumarat bằng cách điều chỉnh khoảng cách thời gian dùng thuốc ở bệnh nhân suy thận dựa trên độ thanh thải creatinin (CrCl) của bệnh nhân:

+ **CrCl 50 ml/phút hoặc lớn hơn:** Dùng liều thông thường 1 lần/ngày.

+ **CrCl 30 đến 49 ml/phút:** Dùng cách nhau mỗi 48 giờ.

+ **CrCl 10 đến 29 ml/phút:** Dùng cách nhau mỗi 72 đến 96 giờ.

+ **Bệnh nhân thẩm phân máu:** Dùng một liều cách nhau mỗi 7 ngày hoặc sau khi thẩm phân 12 giờ.

- Do tính an toàn và hiệu quả của những liều dùng trên chưa được đánh giá nghiên cứu lâm sàng, nên theo dõi chặt chẽ sự đáp ứng lâm sàng của trị liệu và chức năng thận.

Bệnh nhân suy gan

Đối với bệnh nhân suy giảm chức năng gan không cần thiết phải điều chỉnh liều.

CHỐNG CHỈ ĐỊNH

Bệnh nhân mẫn cảm với tenofovir disoproxil fumarat hoặc bất kỳ thành phần nào của thuốc.

THẬN TRỌNG

- Khi dùng tenofovir (cũng như các chất ức chế sao chép ngược (đơn độc hoặc phối hợp)) đã có ghi nhận bệnh nhân nhiễm acid lactic, gan to nghiêm trọng và nhiễm mỡ (có thể tử vong).

- **Tăng sinh mô mỡ:** Sự tái phân bố hay tích tụ mỡ trong cơ thể, bao gồm béo vùng bụng, phì đại mặt trước-sau cổ ("gù trâu"), tàn phá thần kinh ngoại vi, mặt, phì đại tuyến vú, xuất hiện hội chứng Cushing đã được báo cáo khi dùng các thuốc kháng retrovirus.

- **Tác dụng trên xương:** Khi dùng đồng thời tenofovir với lamivudin và efavirenz ở bệnh nhân nhiễm HIV cho thấy có sự giảm mật độ khoáng của xương sống thắt lưng, tăng nồng độ của 4 yếu tố sinh hoá trong chuyển hoá xương, tăng nồng độ hormon tuyến cận giáp trong huyết thanh.

- Cần theo dõi xương chặt chẽ ở những bệnh nhân nhiễm HIV có tiền sử gãy xương do bệnh lý, hoặc có nguy cơ thiếu xương cao. Mặc dù chưa có nghiên cứu về hiệu quả của việc bổ sung calci và vitamin D, nhưng việc bổ sung có thể có ích cho những bệnh nhân này. Khi có những bất thường về xương cần hỏi ý kiến của thầy thuốc.