

Rx_Thuốc bán theo đơn

ALEXAN

Tiêm tĩnh mạch (tiêm truyền hoặc tiêm), tiêm dưới da

1. Tên thuốc: ALEXAN

2. Thành phần thuốc:

1 ml dung dịch có chứa 50,0 mg cytarabin.

Các tá dược: natri lactat, acid lactic, nước cất pha tiêm.

3. Dạng bào chế của thuốc:

Dung dịch tiêm/tiêm truyền

Dung dịch trong suốt và không màu.

4. Tính chất dược lực học:

Phân loại nhóm điều trị được lý: chất chống chuyển hóa (chất đồng đẳng pyrimidin)

Mã ATC: L01BC01

Alexan chứa hoạt chất chính là cytarabin, một chất chống chuyển hóa từ một chuỗi các chất đối kháng pyrimidin.

Cytarabin là một chất chống ung thư đặc hiệu pha trên chu kỳ tế bào, cytarabin chỉ tác động trên các tế bào trong pha S của chu kỳ phân bào. Chất này được đưa vào trong tế bào để chuyển hóa thành cytarabin-5' triphosphat (ara-CTP) là một chất chuyển hóa hoạt động. Cơ chế tác dụng của cytarabin vẫn chưa được tìm hiểu đầy đủ nhưng dường như ara-CTP tác dụng chủ yếu qua việc ức chế ADN polymerase. Việc thâm nhập vào ADN và ARN có thể góp phần vào tác dụng gây độc tế bào của cytarabin. Cytarabin có tác dụng gây độc với các tế bào tăng sinh của động vật có vú trên mô nuôi cấy.

5. Tính chất dược động học:

Hấp thu:

Cytarabin được chuyển hóa nhanh chóng và không có tác dụng khi uống. Dưới 20% liều khi uống được hấp thu qua đường tiêu hóa.

Khi tiêm truyền tĩnh mạch liên tục, cytarabin gần như đạt được nồng độ hằng định trong huyết tương.

Sau khi tiêm dưới da hoặc tiêm bắp, cytarabin đạt được nồng độ đỉnh 20-60 phút sau khi tiêm, thấp hơn rõ rệt so với tiêm tĩnh mạch.



Nồng độ cytarabin trong huyết thanh là khác nhau giữa các bệnh nhân với cùng một mức liều. Một số nghiên cứu đã chỉ ra rằng sự khác biệt này có liên quan đến đáp ứng trên lâm sàng: nồng độ cao trong huyết thanh liên đới với sự thuyên giảm về mặt huyết học.

Cytarabin có thể tích phân bố là 0,7 l/kg.

Chuyển hóa:

Cytarabin được biến đổi nhanh chóng bởi deoxycytidin kinase và các nucleotidase khác thành dạng hoạt động (cytarabin-5' triphosphat) nhờ quá trình phosphoryl hóa trong nguyên bào bạch cầu và trong tủy sống bình thường. Sự chuyển hóa thành dạng không hoạt động hỗn hợp uracilarabinoside (1-beta-D-arabinofuranosyluracil) chủ yếu là nhờ hoạt động của enzym cytidin deaminase trong gan, còn có trong máu và các mô khác ở mức độ ít hơn.

Dường như sự cân đối giữa kinase và deaminase là yếu tố quan trọng xác định tính nhạy cảm hay đề kháng của tế bào đối với cytarabin.

Liên kết protein:

Liên kết với protein huyết tương thấp (13,3%) với nồng độ 0,005-1 mg/l.

Tỷ lệ thuốc liên kết độc lập với nồng độ trong giới hạn điều trị của thuốc.

Thải trừ:

Sau khi tiêm truyền tĩnh mạch cytarabin nhanh, quá trình thải trừ 2 pha trong máu xảy ra. Đầu tiên là pha phân phối có thời gian bán hủy khoảng 10 phút, sau đó là pha thải trừ với thời gian bán hủy là 1-3 giờ.

Sau 24 giờ, xấp xỉ 80% cytarabin được tìm thấy trong nước tiểu, 90% thải trừ ở dạng không hoạt động và 10% thải trừ ở dạng không thay đổi.

Do hoạt tính của cytarabin deaminase trong dịch não tủy thấp nên cytarabin có thời gian bán hủy trong thần kinh trung ương từ 3-3,5 giờ.

Chỉ định điều trị:

Cytarabin được chỉ định điều trị trong các trường hợp:

- Bệnh bạch cầu dòng tủy cấp tính (AML) ở người lớn.
- Các bệnh bạch cầu khác ở người lớn và trẻ em.

Liều dùng và cách dùng:

Chỉ được dùng cytarabin trong các khoa chuyên ngành, bởi các bác sĩ giàu kinh nghiệm trong điều trị hóa chất và điều trị hỗ trợ.



Cytarabin không có tác dụng khi uống. Liều dùng và cách dùng phụ thuộc vào liệu trình điều trị để theo dõi.

Trong quá trình bắt đầu điều trị hóa chất, bác sĩ phải nhận thức rõ ràng về các tác dụng phụ, các biến pháp phòng ngừa, chống chỉ định và các cảnh báo về các thuốc có trong chương trình điều trị.

Cytarabin có thể dùng đơn độc hoặc phối hợp với các thuốc gây độc tế bào hoặc đôi khi là các corticosteroid.

Theo các khuyến cáo chung, bệnh bạch cầu thường điều trị bằng cách phối hợp các thuốc gây độc tế bào trong đó có khoảng 2-5 thuốc được dùng. Với các liệu trình điều trị khác nhau, đề nghị xem các tài liệu chuyên ngành.

Alexan có thể dùng theo đường tiêm tĩnh mạch (tiêm truyền hoặc tiêm), tiêm dưới da. Để chuẩn bị dung dịch truyền, có thể hòa Alexan vào dung dịch NaCl 0,9% hoặc glucose 5%.

Với cùng một mức liều, cytarabin tiêm truyền tĩnh mạch nhanh thì dung nạp tốt hơn là tiêm truyền liên tục. Điều này có liên quan đến tính chất bất hoạt nhanh của thuốc, việc tiêm truyền nhanh dẫn đến kết quả là các tế bào bình thường và tế bào khối u tiếp xúc với các nồng độ của thuốc trong một thời gian ngắn.

Liều dùng:

Điều trị giảm nhẹ:

- Điều trị liên tục:

- Liều khởi đầu nên dùng là 2 mg/kg/ngày, tiêm nhanh trong 10 ngày. Kiểm tra công thức máu hàng ngày. Nếu tác dụng chống ung thư bạch cầu không được ghi nhận và không có dấu hiệu độc tính, tăng liều lên 4 mg/kg/ngày và duy trì cho đến khi đáp ứng điều trị hoặc có độc tính. Hầu hết tất cả các bệnh nhân có dấu hiệu độc tính với liều trên.
- Liều 0,5 - 1,0 mg/kg/ngày có thể được truyền với thời gian lên đến 24 giờ. Phần lớn bệnh nhân đạt được kết quả khả quan ngay sau khi truyền một giờ. Sau điều trị 10 ngày, liều hàng ngày có thể tăng lên 2 mg/kg/ngày tùy thuộc vào phản ứng độc tính. Tiếp tục theo dõi độc tính hoặc cho đến khi có dấu hiệu thuyên giảm.

- Điều trị ngắt quãng:

- Tiêm truyền tĩnh mạch 3 - 5 mg/kg/ngày trong năm ngày liên tục. Sau đó ngừng 2 - 9 ngày, rồi lại tiếp tục liệu trình. Duy trì cho đến khi có đáp ứng hoặc có dấu hiệu độc tính.