

đau vùng chậu, chảy máu âm đạo, tăng tiết dịch âm đạo, khô âm đạo, khí hư.

Huyết học: thiếu máu, giảm bạch cầu.

Gan: tăng enzym gan, tăng phosphatase kiềm, tăng gamma GT.
Tạị chỗ: viêm tắc tĩnh mạch.

Cơ - xương: gãy xương, thoái khớp, loạn cảm, đau khớp, đau cơ, tăng trương lực.

Mắt: đục nhân mắt.

Hô hấp: khó thở, viêm xoang, viêm phế quản, viêm mũi.

Khác: phù bạch huyết, nhiễm khuẩn, hội chứng cúm, tăng tiết mồ hôi, phản ứng ở khối u (khối u to lên đột ngột và gây đau, nổi mẩn, đau nhức xương, calci huyết tăng, nồng độ các chất chỉ điểm khối u tăng).

Ít gặp hoặc hiếm gặp

Phản vệ, phù mạch, tai biến mạch máu não, thiếu máu não, nhồi máu não, ung thư nội mạc tử cung, hồng ban đa dạng, đau khớp, cứng khớp, thiếu máu cơ tim, tắc động mạch phổi, tắc tĩnh mạch võng mạc, hội chứng Stevens-Johnson, mày đay, viêm mạch máu.

Chưa xác định được tần suất

Tâm trạng thay đổi.

Chú ý: Dùng anastrozol có nguy cơ bị ADR về xương - khớp (viêm khớp, thoái khớp, đau khớp, gãy xương) nhiều hơn dùng tamoxifen.

Hướng dẫn cách xử trí ADR

Các ADR của anastrozol thường nhẹ nên ít khi phải ngừng thuốc. Đề phòng và giảm thiểu ADR, bệnh nhân dùng anastrozol cần thay đổi lối sống (ví dụ: vận động, nâng tạ, không hút thuốc lá, kiêng rượu...); bổ sung calci, vitamin D trong khẩu phần hàng ngày. Trước và trong quá trình điều trị bằng anastrozol cần đo mật độ xương và nếu có loãng xương thì cần điều trị.

Điều trị loãng xương bằng bisphosphonat uống. Điều trị sớm các ADR của thuốc nếu có biểu hiện.

Liều lượng và cách dùng

Có thể uống thuốc lúc đói hoặc lúc no. Uống vào một giờ nhất định trong ngày.

Điều trị ung thư vú giai đoạn sớm:

Điều trị hỗ trợ: Anastrozol được sử dụng một mình hoặc như biện pháp hỗ trợ cho phẫu thuật (có hoặc không xạ trị liệu và/hoặc hóa trị liệu). Anastrozol có thể dùng ngay từ đầu hoặc thay thế cho tamoxifen trong trường hợp bệnh nhân không dùng được tamoxifen do nguy cơ bị độc tính của tamoxifen (ví dụ: bị tắc mạch, chảy máu âm đạo kéo dài...). Thử nghiệm lâm sàng cho thấy anastrozol có thể có tác dụng tốt hơn tamoxifen. Liều thường dùng là 1 mg/lần, ngày 1 lần. Thời gian dùng thuốc hỗ trợ (căn cứ trên thử nghiệm lâm sàng) là 5 năm.

Điều trị hỗ trợ kéo dài: Người ta cũng khuyên rằng sau 5 năm dùng tamoxifen làm thuốc điều trị hỗ trợ nên tiếp tục dùng anastrozol trong 2,5 năm nữa. Liều thường dùng là 1 mg/lần, ngày 1 lần.

Điều trị ung thư vú giai đoạn muộn:

Điều trị hàng đầu: Anastrozol được lựa chọn điều trị hàng đầu ung thư vú tiến triển còn khu trú hoặc có di căn có thụ cảm thể hormon dương tính hoặc thụ cảm thể hormon chưa biết rõ ở phụ nữ đã mãn kinh. Liều thường dùng là 1 mg/lần, ngày 1 lần.

Điều trị hàng 2: Anastrozol được sử dụng để điều trị ung thư vú vẫn tiến triển ở phụ nữ đã mãn kinh sau khi dùng tamoxifen. Mục đích của trị liệu này là kéo dài và cải thiện chất lượng cuộc sống cho bệnh nhân ở giai đoạn cuối. Liều thường dùng là 1 mg/lần, ngày 1 lần.

Suy gan nhẹ và vừa: Không cần thiết phải điều chỉnh liều nhưng cần theo dõi các tác dụng phụ. Chưa có dữ liệu trên người bị suy gan nặng.

Suy thận: Không cần thiết phải điều chỉnh liều.

Tương tác thuốc

Không dùng đồng thời anastrozol và các thuốc tác động chọn lọc lên thụ thể estrogen (tamoxifen, raloxifen).

Không dùng đồng thời anastrozol và estrogen vì làm giảm tác dụng của anastrozol.

Quá liều và xử trí

Còn ít dữ liệu về quá liều anastrozol.

Xử trí: Không có thuốc giải độc đặc hiệu. Điều trị triệu chứng, chăm sóc nâng cao thể trạng, theo dõi thường xuyên các dấu hiệu sinh tồn. Có thể gây nôn nếu bệnh nhân tỉnh táo. Vì thuốc ít gắn vào protein huyết tương nên lọc máu có thể có tác dụng.

Cập nhật lần cuối: 2018.

ANTI THYMOCYTE GLOBULIN (THỎ)

Tên chung quốc tế: Antithymocyte globulin (rabbit).

Mã ATC: L04AA04.

Loại thuốc: Thuốc ức chế miễn dịch.

Dạng thuốc và hàm lượng

Dung dịch tiêm truyền tĩnh mạch: Lọ 100 mg/5 ml.

Bột đông khô pha dung dịch tiêm truyền tĩnh mạch: Lọ 25 mg kèm dung môi hòa tan dùng một lần.

Được lực học

Anti thymocyte globulin thỏ (ATG thỏ) là thuốc ức chế miễn dịch có bản chất là kháng thể đa dòng. ATG thỏ chứa immunoglobulin G (gamma globulin, IgG) được điều chế từ huyết thanh thỏ khỏe mạnh kháng lại kháng nguyên biểu hiện trên tế bào tuyến ức của người. Mặc dù cơ chế hoạt động chính xác của ATG thỏ chưa rõ, tuy nhiên hoạt động của ATG thỏ dường như liên quan đến việc thải trừ tế bào lympho T cảm ứng kháng nguyên ngoại biên (tế bào T) khỏi hệ tuần hoàn, điều hòa sự hoạt hóa tế bào T, sự trở về ổ cư trú (homing), và gây độc tế bào. ATG thỏ chứa kháng thể liên kết với các thụ thể bề mặt tế bào T như CD2, CD3, CD4, CD8, CD11a, CD18, CD25, CD44, CD45, HLA-DR, các chuỗi nặng của HLA lớp I và microglobulin beta₂. Sự suy giảm tế bào T thường xảy ra trong vòng một ngày khi điều trị với ATG thỏ. ATG thỏ không có hiệu quả trong điều trị các thái ghép qua trung gian kháng thể dịch thể.

Được động học

Sau khi tiêm truyền liều đầu tiên 1,25 mg/kg ATG thỏ (ở những bệnh nhân ghép thận), IgG tổng trong huyết thanh dao động từ 10 - 40 microgam/ml, t_{1/2} khoảng 2 - 3 ngày. Thức ăn và rượu không ảnh hưởng đến dược động học của thuốc.

Nồng độ IgG thỏ tăng dần từ 20 đến 170 microgam/ml vào cuối của đợt điều trị 11 ngày. Vẫn có thể phát hiện IgG tổng trên 81% bệnh nhân sau 2 tháng điều trị. ATG thỏ hoạt động (tương ứng với IgG có thể gắn vào tế bào lympho người gây ra tác dụng ức chế miễn dịch mong muốn) ít có quan hệ với liều dùng và biến mất khỏi hệ tuần hoàn nhanh hơn. Chỉ 12% bệnh nhân có thể phát hiện ATG thỏ hoạt động ở ngày thứ 90.

Sự tạo miễn dịch đáng kể đối với IgG thỏ được quan sát thấy trên khoảng 40% bệnh nhân. Trong hầu hết các trường hợp, sự tạo miễn dịch phát triển trong vòng 15 ngày đầu điều trị. Bệnh nhân có sự tạo miễn dịch này có IgG tổng giảm nhanh hơn nhưng không có IgG hoạt động.

Chỉ định

Dự phòng thải ghép trên bệnh nhân ghép tim.

Dự phòng thải ghép trên bệnh nhân ghép thận.

Điều trị thải ghép kháng corticosteroid trong cấy ghép thận.

Chống chỉ định

Mẫn cảm với các protein từ thỏ. Nhiễm trùng cấp tính hoặc mạn tính. Nhiễm virus cấp.

Thận trọng

ATG thỏ nên được sử dụng bởi các bác sĩ lâm sàng có kinh nghiệm trong việc sử dụng thuốc ức chế miễn dịch.

Cần giám sát chặt chẽ trong suốt và sau khi tiêm truyền ATG thỏ.

Sốc phản vệ

Sốc phản vệ hiếm khi xảy ra khi điều trị với ATG thỏ. Nếu sốc phản vệ hoặc phản ứng quá mẫn nghiêm trọng xảy ra cần dừng sử dụng ATG thỏ ngay lập tức và có can thiệp thích hợp.

Biến chứng nhiễm trùng và bệnh ác tính

Điều trị bằng ATG thỏ có thể làm tăng nguy cơ biến chứng nhiễm trùng và những bệnh ác tính. Để giảm nguy cơ nhiễm trùng nghiêm trọng, nhà sản xuất khuyến cáo bệnh nhân nên được điều trị dự phòng nhiễm trùng thích hợp, bao gồm sử dụng thuốc kháng virus, kháng động vật nguyên sinh và/hoặc các thuốc kháng nấm. Điều trị ATG thỏ kéo dài hoặc quá liều khi kết hợp với các thuốc ức chế miễn dịch khác có thể làm tăng nguy cơ u lympho hoặc bệnh tăng sinh lympho sau phẫu thuật (PTLD).

Diệt tế bào T, giảm bạch cầu và giảm tiểu cầu

Giảm tế bào T xảy ra trong khi điều trị ATG thỏ, số lượng tế bào lympho (tổng số lượng tế bào lympho và/hoặc tế bào T) nên được theo dõi. Giảm bạch cầu hoặc tiểu cầu hồi phục có thể xảy ra. Cần điều chỉnh liều hoặc ngừng sử dụng ATG thỏ khi cần thiết.

Hình thành kháng thể

Kháng thể kháng kháng thể thỏ (anti-rabbit antibodies) phát triển trên 68% bệnh nhân ghép thận được điều trị với ATG thỏ trong 7 - 14 ngày. Những kháng thể kháng kháng thể thỏ này vẫn còn hiện diện trên 24% bệnh nhân trong 90 ngày. Mặc dù sự có mặt của kháng thể kháng thỏ không tương quan tới sự điều trị thành công hay thất bại của liệu pháp ATG thỏ trên những bệnh nhân này, nhưng tác dụng của các kháng thể này lên hiệu quả điều trị của ATG thỏ trong quá trình điều trị tiếp theo vẫn chưa được đánh giá.

Ảnh hưởng đến khả năng lái xe và vận hành máy

Do các ADR có thể xảy ra trong thời gian truyền ATG thỏ, đặc biệt là hội chứng giải phóng cytokin, do đó bệnh nhân không nên lái xe hoặc vận hành máy móc khi đang sử dụng ATG thỏ.

Thời kỳ mang thai

Hiện tại chưa có kết luận liệu ATG thỏ có thể gây hại cho thai nhi hoặc có thể ảnh hưởng đến khả năng sinh sản hay không. Tuy nhiên chỉ nên dùng ATG thỏ cho phụ nữ mang thai khi thật cần thiết. Nam giới và nữ giới trong độ tuổi sinh sản nên sử dụng các biện pháp tránh thai trong và sau khi điều trị với ATG thỏ 3 tháng.

Thời kỳ cho con bú

Không biết liệu ATG thỏ có được bài tiết vào sữa hay không. Tuy nhiên, nhiều loại thuốc được phân bố vào sữa mẹ, bao gồm các kháng thể. Do vậy, nên ngừng cho con bú trong khi điều trị với ATG thỏ.

Tác dụng không mong muốn (ADR)**Rất thường gặp**

Tim mạch: tăng huyết áp (18 - 37%), phù ngoại vi (20%), nhịp tim nhanh (7 - 23%).

Máu: thiếu máu (25%), giảm bạch cầu (57 - 63%), giảm tiểu cầu (9 - 29%).

Nội tiết, chuyển hóa: tăng kali huyết (27 - 57%).

Tiêu hóa: đau bụng (37,8%), táo bón (33%), tiêu chảy (6 - 20%), buồn nôn (36,6%).

Cơ - xương: đau cơ (11 - 20%).

Thần kinh, tâm thần: đau đầu (18 - 40%), lo âu (14%).

Khác: sốt (29 - 46%), khó thở (28%), run rẩy (9 - 57%).

Khác: bệnh nhiễm trùng (76%), nhiễm trùng đường tiết niệu (42%).

Thường gặp

Toàn thân: ngứa, phát ban.

Máu: bệnh về huyết thanh (gây phát ban, ngứa, nổi mề đay (ngứa, đỏ), khớp đau, các vấn đề về thận và sưng hạch bạch huyết phát triển trong vòng 6 - 21 ngày).

Tiêu hóa: khó nuốt, nôn mửa.

Gan: tăng enzym gan.

Khác: đau cơ, tăng trưởng khối u (bao gồm ung thư và không ung thư), khó thở.

Ít gặp

Tổn thương gan (suy gan), hội chứng giải phóng cytokin (CRS), sốc phản vệ, suy thận cấp, các phản ứng liên quan đến truyền dịch.

Liều lượng và cách dùng

Cách dùng: Anti thymocyte globulin thỏ được tiêm truyền tĩnh mạch.

Liều đầu tiên của ATG thỏ nên được tiêm truyền trong ít nhất 6 giờ và những liều sau trong ít nhất 4 giờ. Để ngăn ngừa những phản ứng liên quan đến tiêm truyền, nhà sản xuất khuyến cáo nên tiền điều trị ATG thỏ với corticosteroid (ví dụ methylprednisolon tiêm tĩnh mạch 2 - 5 mg/kg), acetaminophen uống (500 - 650 mg) và/hoặc thuốc kháng histamin (ví dụ diphenhydramin uống hoặc tiêm tĩnh mạch 25 mg), 1 giờ trước mỗi liều ATG thỏ. Nếu có biểu hiện của các phản ứng tiêm truyền (ví dụ, ớn lạnh, sốt) hoặc nếu bệnh nhân đang dùng liều ATG thỏ lớn hơn 1,5 mg/kg mỗi ngày, có thể cho bệnh nhân dùng thêm corticosteroid hoặc tăng thời gian truyền (kéo dài hơn 12 giờ).

ATG thỏ đông khô được hòa tan và pha loãng trước khi sử dụng bằng kỹ thuật vô trùng thích hợp. Vì ATG không chứa chất bảo quản nên mặc dù dung dịch ATG thỏ ổn định ở nhiệt độ phòng trong 24 giờ, chỉ nên dùng dung dịch này trong vòng 4 giờ sau khi pha ở nhiệt độ phòng. Dung dịch ATG thỏ sau khi hòa tan chỉ được dùng một lần.

Nên đưa ATG thỏ và dung dịch pha loãng về nhiệt độ phòng trước khi hòa tan. Mỗi lọ chứa 25 mg ATG thỏ bột đông khô được hòa tan trong 5 ml dung dịch pha loãng được cung cấp bởi nhà sản xuất để thu được dung dịch có nồng độ 5 mg/ml. Trong quá trình pha, dung dịch ATG thỏ được kiểm tra trực quan các tiểu phân lạ, nếu vẫn còn các tiểu phân này tiếp tục xoay lọ nhẹ nhàng cho đến khi các tiểu phân này biến mất. Cần thái bỏ những dung dịch ATG thỏ vẫn còn các tiểu phân này. Dung dịch hòa tan phải trong suốt và không nên sử dụng nếu bị đổi màu. Liều thích hợp của ATG thỏ thu được bằng cách pha loãng trong dung dịch natri clorid 0,9% hoặc dung dịch dextrose 5% tiêm truyền. Mỗi lọ ATG thỏ nên được pha loãng trong 50 ml dung dịch tiêm truyền và tổng thể tích dung dịch tiêm truyền thông thường là 50 - 500 ml. Nồng độ cuối cùng của dung dịch ATG thỏ sau khi hòa tan và pha loãng xấp xỉ 0,5 mg/ml. Cuối cùng dung dịch ATG thỏ pha loãng nên được trộn nhẹ nhàng bằng cách lộn ngược túi tiêm truyền nhẹ nhàng 1 hoặc 2 lần.

ATG thỏ nên được lọc qua màng lọc 0,22 micromét trong hệ thống nội tuyến vào van dòng chảy mạnh.

ATG thỏ chỉ sử dụng một lần, phần thuốc nào còn lại chưa sử dụng nên được loại bỏ.

Liều lượng

Dự phòng thải ghép cấp tính trên bệnh nhân ghép thận: 1,5 mg/kg/ngày trong 4 - 7 ngày với liều đầu tiên được dùng trước khi thận tái cấy máu.

Điều trị thải ghép thận cấp tính: 1,5 mg/kg/ngày trong 7 - 14 ngày. Những bệnh nhân đang dùng các thuốc ức chế miễn dịch khác (ví dụ azathioprin, prednison, cyclosporin), vẫn tiếp tục dùng cùng với ATG thỏ.

Dự phòng tái ghép trên bệnh nhân ghép tim: 1 - 2,5 mg/kg/ngày trong 3 - 5 ngày, được truyền trong ít nhất 6 giờ.

Điều chỉnh liều ATG thô: Liều ATG thô giảm ở những bệnh nhân giảm bạch cầu và/hoặc giảm tiểu cầu. Nếu số lượng bạch cầu là 2 000 - 3 000/mm³ hoặc số lượng tiểu cầu là 50 000 - 75 000/mm³, nên giảm 50% liều. Ngừng thuốc nếu số lượng bạch cầu dưới 2 000/mm³ hoặc số lượng tiểu cầu dưới 50 000/mm³.

Tương tác thuốc

Thuốc ức chế miễn dịch

Có tương tác dược lý tiềm tàng (tác dụng ức chế miễn dịch phụ). ATG thô thường được sử dụng kết hợp với các thuốc ức chế miễn dịch khác, điều này có thể gây suy giảm miễn dịch quá mức. Cần cân nhắc sự ức chế miễn dịch bị giảm trong khi điều trị với ATG thô.

Tương kỵ

Dựa trên một nghiên cứu về tương thích duy nhất cho thấy sự kết hợp của ATG thô, heparin và hydrocortison trong dung dịch tiêm truyền dextrose kết tủa và không được khuyến cáo sử dụng.

Trong trường hợp không có dữ liệu về tính tương kỵ của ATG thô, không nên trộn lẫn ATG thô với các sản phẩm thuốc khác trong cùng một lần truyền.

Không có sự tương tác của ATG thô với chai thủy tinh hoặc túi nhựa polyvinyl clorua (PVC).

Quá liều và xử trí

Quá liều ATG thô có thể gây giảm bạch cầu (bao gồm giảm bạch cầu và giảm bạch cầu trung tính) và giảm tiểu cầu.

Cập nhật lần cuối: 2018.

APIXABAN

Tên chung quốc tế: Apixaban.

Mã ATC: B01AF02.

Loại thuốc: Thuốc chống huyết khối, thuốc ức chế trực tiếp yếu tố Xa.

Dạng thuốc và hàm lượng

Viên nén bao phim: 2,5 mg, 5 mg.

Dược lực học

Tác dụng: Apixaban là chất ức chế yếu tố Xa làm ngăn chặn tạo thrombin và hình thành huyết khối. Apixaban ức chế yếu tố Xa, làm kéo dài các chỉ số xét nghiệm đông máu như thời gian prothrombin (PT), INR và thời gian thromboplastin hoạt hóa một phần (aPTT). Thay đổi quan sát được trong các xét nghiệm đông máu này ở khoảng liều điều trị là nhỏ và có mức độ biến thiên cao giữa các cá thể, không dùng để đánh giá tác dụng dược lực học của apixaban. Trong thử nghiệm tạo thrombin, apixaban làm giảm khả năng tạo thrombin nội sinh trong huyết tương.

Thêm vào đó, hoạt tính kháng yếu tố Xa của apixaban biểu hiện bằng giảm hoạt tính của enzym yếu tố Xa trong nhiều bộ kit thương mại kháng yếu tố Xa, tuy nhiên kết quả khác nhau giữa các bộ kit. Hoạt tính kháng yếu tố Xa có mối tương quan tuyến tính chặt chẽ với nồng độ apixaban trong huyết tương, đạt giá trị tối đa tại thời điểm nồng độ C_{max} apixaban và trên phạm vi liều rộng của apixaban, mối tương quan gần như tuyến tính.

Cơ chế tác dụng: Apixaban là chất ức chế trực tiếp, có thể đảo ngược và có tính chọn lọc cao với yếu tố Xa. Apixaban không yêu cầu antithrombin III cho tác dụng chống huyết khối. Bằng cách ức chế yếu tố Xa, apixaban ngăn chặn tạo thành thrombin và phát triển huyết khối. Apixaban không tác dụng trực tiếp lên kết tập tiểu cầu, nhưng gián tiếp ức chế kết tập tiểu cầu do thrombin gây ra.

Các nghiên cứu tiền lâm sàng về apixaban trên mô hình động vật đã chứng minh hiệu quả chống huyết khối của apixaban trong phòng ngừa huyết khối động mạch và tĩnh mạch ở liều duy trì cầm máu.

Dược động học

Hấp thu: Sinh khả dụng tuyệt đối của apixaban khoảng 50% đối với liều lên đến 10 mg. Apixaban được hấp thu nhanh chóng, C_{max} đạt được ở khoảng 3 - 4 giờ sau khi uống. Uống apixaban 10 mg cùng với thức ăn không ảnh hưởng đến AUC hoặc C_{max}. Apixaban có thể được dùng cùng hoặc không cùng thức ăn.

Apixaban có dược động học tuyến tính, AUC tăng cùng với tăng liều đến 10 mg. Ở liều ≥ 25 mg apixaban, hấp thu thuốc bị giảm và sinh khả dụng giảm do độ hòa tan bị hạn chế. Các thông số AUC thay đổi từ thấp đến trung bình giữa các cá thể tương ứng là CV 20% và CV 30%.

Sau khi uống 10 mg apixaban dưới dạng 2 viên nén 5 mg nghiền nát trong 30 ml nước, AUC tương đương với uống 2 viên nén 5 mg nguyên vẹn.

Sau khi uống 10 mg apixaban dưới dạng 2 viên nén 5 mg nghiền nát với 30 g táo xay nhuyễn, C_{max} thấp hơn 21% và AUC thấp hơn 16% so với uống 2 viên nén 5 mg nguyên vẹn. Nhưng sự giảm AUC này được cho là không ảnh hưởng lâm sàng.

Khi dùng một viên nén apixaban 5 mg nghiền trong 60 ml glucose 5% và đưa qua đường sond mũi - dạ dày, AUC tương tự như người khỏe mạnh uống một viên apixaban 5 mg. AUC ở nữ cao hơn 18% so với nam giới.

AUC apixaban bị ảnh hưởng bởi cân nặng, người có cân nặng > 120 kg: AUC thấp hơn khoảng 30% và người cân nặng < 50 kg: AUC cao hơn khoảng 30% (so với AUC ở những người cân nặng 65 - 85 kg).

Phân bố: Apixaban liên kết với protein huyết tương khoảng 87%. V_d khoảng 21 lít.

Chuyển hóa: Apixaban được chuyển hóa chủ yếu qua CYP3A4 cùng với góp phần nhỏ của CYP1A2, 2C8, 2C9, 2C19 và 2J2. O-demethyl hóa và hydroxyl hóa ở gốc 3-oxopiperidinyl là những vị trí chính của quá trình chuyển dạng sinh học. Apixaban không chuyển hóa là thành phần chính của thuốc trong huyết tương, không có chất chuyển hóa có hoạt tính trong máu. Apixaban là chất nền của protein vận chuyển, P-gp và protein kháng ung thư vú (BCRP, breast cancer resistance protein). Khoảng 25% liều uống apixaban được tìm thấy trong phân và nước tiểu dưới dạng chất chuyển hóa.

Thải trừ: Apixaban được thải trừ qua phân và nước tiểu. Bài tiết apixaban qua thận chiếm 27% tổng thành thải. Phần còn lại bài tiết qua mật trực tiếp vào ruột và thải trừ qua phân.

Apixaban có tổng độ thanh thải khoảng 3,3 lít/giờ và nửa đời thải trừ khoảng 12 giờ.

Tương quan dược động học/dược lực học của apixaban

Mối tương quan giữa nồng độ apixaban trong huyết tương và hoạt tính kháng yếu tố Xa được mô tả trên các thông số tác dụng kháng yếu tố Xa, INR, PT, aPTT là mô hình tuyến tính. Mối tương quan dược động học/dược lực học ở bệnh nhân phù hợp với mối tương quan xây dựng được ở người khỏe mạnh.

Dược động học ở quần thể đặc biệt

Người cao tuổi (trên 65 tuổi) có nồng độ thuốc trong huyết tương cao hơn người trẻ. AUC trung bình cao hơn khoảng 32% và không có sự khác biệt về C_{max}.

Người suy thận:

Suy giảm chức năng thận không ảnh hưởng tới C_{max} apixaban. Mức tăng AUC apixaban tương quan với mức giảm chức năng thận, được đánh giá qua Cl_r. Ở những người bị suy thận nhẹ (Cl_r 51 - 80 ml/phút), trung bình (Cl_r 30 - 50 ml/phút) và suy thận nặng (Cl_r 15 - 29 ml/phút), AUC tăng lên tương ứng 16%, 29% và 44%