

Hướng dẫn sử dụng thuốc
Rx Thuốc bán theo đơn

CALCITRIOL

Dạng thuốc: Viên nang mềm.

Qui cách đóng gói: Hộp 3 vỉ x 10 viên nang mềm, hộp 10 vỉ x 10 viên nang mềm.

Thành phần: Mỗi viên nang mềm chứa:

Calcitriol.....0,25mcg
Tá dược.....vũ viên
(Tá dược gồm: Dầu đậu nành, sunset yellow, nipagin, nipasol, gelatin, glycerin, vanilin, sorbitol 70%, titan dioxyd)

DƯỢC LỰC HỌC:

Calcitriol, một trong những chất chuyển hóa có hoạt tính của vitamin D₃, bình thường được tạo thành ở thận từ một tiền chất của nó là 25-hydroxycholecalciferol (25-HCC). Bình thường, lượng chất này được hình thành mỗi ngày là 0,5-1,0 mg, và tăng nhiều hơn trong giai đoạn mà sự tạo xương tăng cao (chẳng hạn trong giai đoạn tăng trưởng hoặc lúc có thai). Calcitriol làm thuận lợi cho sự hấp thu calci ở ruột và điều tiết sự khoáng hóa xương.

Calcitriol đóng vai trò chủ chốt trong sự điều hòa bất biến nội môi của calci, đồng thời kích thích sự tạo xương, đây là một cơ sở được lý cho tác động điều trị chứng loãng xương.

Ở bệnh nhân bị suy thận nặng, sự tổng hợp calcitriol nội sinh giảm và có thể ngưng hoàn toàn. Thiếu calcitriol trong trường hợp này là nguyên nhân chính gây loạn dưỡng xương do thận.

Ở bệnh nhân bị loãng xương do thận, Calcitriol uống làm bình thường hóa sự hấp thu calci vốn đã bị suy giảm ở ruột, như thể điều chỉnh tình trạng hạ calci huyết và các nồng độ cao trong huyết thanh của phosphat kiềm và hormon cận giáp. Calcitriol làm giảm các chứng đau xương và cơ, điều chỉnh các tình trạng sai lệch về mô học ở bệnh viêm xương xơ hóa và rối loạn khác của sự khoáng hóa.

Ở những bệnh nhân bị thiếu năng tuyến cận giáp sau phẫu thuật, thiếu năng tuyến cận giáp tự phát hay thiếu năng tuyến cận giáp giả, dùng Calcitriol sẽ làm giảm hạ calci huyết cũng như cải thiện các triệu chứng trên lâm sàng.

Ở những bệnh nhân bị còi xương có đáp ứng với vitamin D, nồng độ của calcitriol trong huyết thanh thấp, thậm chí không có. Do việc tạo calcitriol nội sinh ở thận không đủ, việc dùng Calcitriol phải được xem như là một trị liệu thay thế.

Ở những bệnh nhân bị còi xương không đáp ứng với vitamin D (còi xương giảm phosphat huyết nguyên phát), phối hợp với nồng độ calcitriol thấp trong huyết tương, việc điều trị bằng Calcitriol làm giảm sự đào thải phosphat qua ống thận và bình thường hóa việc hình thành xương do bổ sung nguồn phosphor.

Ngoài ra, việc điều trị bằng Calcitriol tỏ ra có ích ở những bệnh nhân bị các dạng còi xương khác, chẳng hạn còi xương có liên quan đến viêm gan ở trẻ sơ sinh, thiếu phát triển đường mật, bệnh loạn dưỡng cystin hoặc việc cung cấp calci và vitamin D qua thức ăn không đầy đủ.

DƯỢC ĐỘNG HỌC:

Hấp thu: Calcitriol được hấp thu nhanh ở ruột. Sau khi uống liều duy nhất 0,25 đến 1 mcg Calcitriol, các nồng độ tối đa đạt được sau 3 đến 6 giờ.

Sau khi uống lặp lại nhiều lần, nồng độ của calcitriol trong huyết thanh đạt tình trạng cân bằng sau 7 ngày.

Phân phối: Hai giờ sau khi uống liều duy nhất 0,5 mcg Calcitriol, các nồng độ trung bình trong huyết thanh của calcitriol tăng từ 40,0 +/- 4,4 pg/ml đến 60,0 +/- 4,4 pg/ml, và giảm còn 53,0 +/- 6,9 pg/ml sau 4 giờ, 50 +/- 7,0 pg/ml sau 8 giờ, 44 +/- 4,6 pg/ml sau 12 giờ và 41,5 +/- 5,1 pg/ml sau 24 giờ.

Calcitriol và các chất chuyển hóa khác của vitamin D liên kết với những protein chuyển biệt của huyết tương trong quá trình vận chuyển trong máu.

Calcitriol có nguồn gốc ngoại sinh qua được hàng rào nhau thai và bài tiết qua sữa mẹ.

Chuyển hóa: Nhiều chất chuyển hóa khác nhau của calcitriol, thể hiện các tác động khác nhau của vitamin D, đã được nhận dạng: 1a, 25-dihydroxy-24-oxo-cholecalciferol, 1a, 24R, 25-hydroxy-24-oxo-cholecalciferol, 1a, 24R, 25-trihydroxycholecalciferol, 1a, 25R-dihydroxycholecalciferol-26, 23S-lactone, 1a, 25S, 26-trihydroxycholecalciferol, 1a, 25-dihydroxy-23-oxo-cholecalciferol, 1a, 25R, 26-trihydroxy-23-oxo-cholecalciferol và 1a-hydroxy-23-carboxy-24, 25, 26, 27-tetranorcholecalciferol.

Đào thải: Thời gian bán hủy đào thải của calcitriol khoảng 9 đến 10 giờ. Tuy nhiên thời gian duy trì tác dụng được lý của một liều duy nhất khoảng 7 ngày. Calcitriol được bài tiết qua mật và chịu ảnh hưởng của chu kỳ gan-ruột. 24 giờ sau khi tiêm tĩnh mạch calcitriol được đánh dấu phóng xạ ở người khỏe mạnh, khoảng 27% hoạt tính phóng xạ được tìm thấy trong phân và khoảng 7% trong nước tiểu. 24 giờ sau khi uống liều 1 mcg calcitriol được đánh dấu phóng xạ ở người khỏe mạnh, khoảng 10% liều calcitriol có đánh dấu được tìm thấy trong nước tiểu. Lượng đào thải tổng cộng của hoạt tính phóng xạ trong 6 ngày sau khi tiêm tĩnh mạch calcitriol được đánh dấu phóng xạ chiếm khoảng 16% trong nước tiểu và 36% trong phân.

CHỈ ĐỊNH:

Loãng xương sau mãn kinh.

Loạn dưỡng xương do thận ở bệnh nhân bị suy thận mãn, đặc biệt ở bệnh nhân làm thẩm phân máu.

Thiếu năng tuyến cận giáp sau phẫu thuật.

Thiếu năng tuyến cận giáp nguyên phát.

Thiếu năng tuyến cận giáp giả.

Còi xương đáp ứng với vitamin D.

Còi xương kháng với vitamin D, kèm theo giảm phosphat huyết.

CHỐNG CHỈ ĐỊNH:

Chống chỉ định Calcitriol (hoặc tất cả các thuốc cùng nhóm) trong những chứng bệnh có liên quan đến tăng calci huyết, cũng như khi có quá mẫn cảm với một trong những thành phần của thuốc.

Calcitriol cũng bị chống chỉ định nếu có dấu hiệu rõ ràng ngộ độc vitamin D.

THẬN TRỌNG LÚC DÙNG:

Giữa việc điều trị bằng calcitriol và tăng calci huyết có mối tương quan chặt chẽ. Trong các nghiên cứu trên bệnh loạn dưỡng xương có nguồn gốc do thận, có gần 40% bệnh nhân được điều trị bằng calcitriol có tăng calci huyết. Nếu tăng đột ngột cung cấp calci do thay đổi thói quen ăn uống (như ăn hoặc uống nhiều sản phẩm chế biến từ sữa) hoặc dùng không kiểm soát các thuốc có chứa calci có thể sẽ gây tăng calci huyết. Nên khuyến bệnh nhân chấp hành tốt chế độ ăn uống và thông báo cho bệnh nhân về những triệu chứng của tăng calci huyết có thể xảy ra.

Bệnh nhân nằm bất động lâu ngày, chẳng hạn sau phẫu thuật, dễ có nguy cơ bị tăng calci huyết.

Bệnh nhân có chức năng thận bình thường, nếu xảy ra tăng calci huyết mãn tính có thể sẽ phối hợp với tăng creatinin huyết thanh.

Đặc biệt thận trọng khi dùng cho bệnh nhân có tiền sử bị sỏi thận hoặc bệnh mạch vành.

Calcitriol làm tăng nồng độ các phosphat vô cơ trong huyết thanh. Trong khi tác dụng này được mong muốn ở những bệnh nhân bị hạ phosphat huyết, cần phải thận trọng ở bệnh nhân bị suy thận, do nguy cơ gây vôi hóa lạc chỗ. Trong những trường hợp này, nên duy trì nồng độ phosphat trong huyết tương ở mức bình thường (2 đến 5 mg/100 ml, tương ứng 0,65 đến 1,62 mmol/l) bằng cách dùng các chất tạo phức chelat với phosphor như hydroxyd hay carbonat.

Ở bệnh nhân bị còi xương kháng vitamin D (còi xương giảm phosphat huyết gia đình) và được điều trị bằng Calcitriol, nên tiếp tục dùng thêm phosphat bằng đường uống. Tuy nhiên cũng nên lưu ý đến khả năng Calcitriol có thể kích thích sự hấp thu phosphat ở ruột, vì điều này có thể làm thay đổi nhu cầu về phosphate bổ sung.

Nên đều đặn kiểm tra nồng độ calci, phosphor, magnesi và phosphat kiềm trong huyết thanh, cũng như nồng độ của calci và phosphat trong nước tiểu trong 24 giờ. Trong giai đoạn đầu điều trị bằng Calcitriol, nên kiểm tra nồng độ calci trong huyết tương ít nhất 2 lần mỗi tuần (xem Liều lượng và Cách dùng).