

thích ứng với độ dài của đầu kim (như dùi bèn, cánh tay trên). Với các chế phẩm tiêm dưới da không dùng kim, nên tiêm dưới da bụng (tránh vùng 5 cm quanh rốn) hoặc dùi với độ dày dưới da đủ để thích ứng với sự xâm nhập dung dịch tiêm vào khoảng không gian dưới da. Thuốc cũng có thể phun xịt vào mũi. Sumatriptan không được tiêm tĩnh mạch vì có nguy cơ gây co thắt động mạch vành. Với các chế phẩm chứa sumatriptan succinat, liều được tính theo sumatriptan.

Liều lượng

Người lớn:

Điều trị cơn đau nửa đầu cấp:

Viên: Liều khuyến cáo uống 1 viên 50 mg, nên uống càng sớm càng tốt ngay sau khi cơn đau bắt đầu, mặc dù hiệu quả của thuốc có tác dụng ở bất cứ giai đoạn nào của cơn đau.

Nếu bệnh nhân không đáp ứng với liều đầu, không nên uống thêm liều thứ 2 trong cùng một cơn. Trong trường hợp này, có thể dùng paracetamol, aspirin hoặc các thuốc chống viêm không steroid khác. Sumatriptan có thể dùng cho những cơn đau tiếp theo.

Nếu sau khi uống viên đầu tiên đã đỡ nhưng các triệu chứng lại tái lại, có thể dùng một viên thứ hai trong 24 giờ sau, với điều kiện phải bảo đảm một khoảng cách ít nhất 2 giờ giữa 2 lần uống. Liều 100 mg có thể cần cho một số người bệnh khi liều 50 mg không hiệu quả. Không được vượt quá 300 mg/24 giờ, giữ một khoảng cách tối thiểu 2 giờ giữa 2 lần uống.

Dung dịch xịt mũi: Liều khuyến cáo 10 - 20 mg: 1 nhát xịt vào một lỗ mũi, cũng có thể dùng liều 10 mg bằng cách xịt 5 mg vào 2 lỗ mũi. Liều 10 mg đã có hiệu quả và nên dùng đầu tiên. Nếu không đỡ sau nhát xịt đầu, không khuyến cáo xịt liều thứ 2 trong cùng một cơn. Tuy vậy, cơn này có thể điều trị bằng paracetamol, aspirin hoặc các thuốc chống viêm không steroid khác. Nếu đã đỡ với liều đầu tiên nhưng các triệu chứng lại xuất hiện lại, có thể dùng một liều thứ hai trong 24 giờ sau, với điều kiện phải bảo đảm một khoảng cách tối thiểu 2 giờ giữa 2 lần dùng thuốc. Không dùng quá 40 mg trong 24 giờ.

Dung dịch tiêm: Cơn đau nửa đầu: 6 mg tiêm dưới da càng sớm càng tốt (có thể sử dụng mức liều thấp hơn nếu bệnh nhân gặp ADR do thuốc). Nếu không đỡ sau mũi tiêm đầu, không khuyến cáo tiêm mũi thứ hai trong cùng một cơn. Sumatriptan có thể dùng cho cơn sau. Nếu đã đỡ sau mũi tiêm đầu, nhưng triệu chứng trở lại, có thể tiêm mũi thứ hai trong 24 giờ sau, với điều kiện bảo đảm một khoảng cách tối thiểu 1 giờ giữa 2 lần tiêm. Tối đa 12 mg/ngày.

Điều trị cơn cấp của đau đầu chuỗi (đau đầu từng cơn - cluster headache): Sử dụng dạng dung dịch xịt mũi hoặc tiêm dưới da với liều tương tự liều điều trị cơn đau nửa đầu cấp.

Đối tượng đặc biệt:

Trẻ em dưới 18 tuổi: Không khuyến cáo dùng vì chưa nghiên cứu đầy đủ về tính an toàn và hiệu quả.

Người cao tuổi: Không khuyến cáo dùng cho người trên 65 tuổi vì chưa có nghiên cứu đầy đủ.

Bệnh nhân suy thận: Không cần hiệu chỉnh liều.

Bệnh nhân suy gan từ nhẹ đến trung bình: Không cần hiệu chỉnh liều với dạng xịt mũi và tiêm dưới da, tuy nhiên với dạng uống do sinh khả dụng của thuốc tăng, không nên uống quá 1 liều đơn 50 mg cho mỗi lần sử dụng.

Bệnh nhân suy gan nặng: Chống chỉ định.

Tương tác thuốc

Tránh dùng phối hợp sumatriptan với bất cứ thuốc nào sau đây:

Dẫn chất ergot (cựa lữa mạch), ergotamin hoặc các triptan/các thuốc chủ vận trên receptor 5-HT₁ khác, các IMAO, dapoxetin. Do tăng nguy cơ co thắt động mạch vành, chỉ nên sử dụng sumatriptan sau khi dùng các chế phẩm chứa ergotamin, các triptan khác/các

thuốc chủ vận trên receptor 5-HT₁ khác ít nhất 24 giờ. Ngược lại, chỉ nên sử dụng các chế phẩm chứa ergotamin ít nhất 6 giờ sau khi dùng sumatriptan, dùng các triptan /các thuốc chủ vận trên receptor 5-HT₁ khác ít nhất 24 giờ sau khi dùng sumatriptan.

Thận trọng khi phối hợp

Sumatriptan có thể làm tăng nồng độ/tác dụng của các thuốc chống loạn thần, droxidopa, metoclopramid, các thuốc điều hòa serotonin. Các thuốc chống nôn (kháng 5HT₃), các thuốc chống loạn thần, metaxon có thể làm tăng nồng độ/tác dụng của sumatriptan, do vậy cần thận trọng khi phối hợp.

Làm giảm tác dụng: Chưa biết có tương tác quan trọng nào làm giảm hiệu lực của sumatriptan.

Quá liều và xử trí

Liều duy nhất tới 40 mg (xịt mũi), trên 16 mg tiêm dưới da và uống 400 mg không gây ADR nào ngoài các ADR thông báo. Trong trường hợp quá liều, phải theo dõi người bệnh ít nhất 10 giờ và điều trị triệu chứng, nếu cần. Chưa rõ tác dụng của thẩm phân máu và màng bụng đối với nồng độ sumatriptan trong huyết tương.

Cập nhật lần cuối: 2020.

SUXAMETHONIUM CLORID (Succinylcholin clorid)

Tên chung quốc tế: Suxamethonium chloride.

Mã ATC: M03AB01.

Loại thuốc: Thuốc chẹn thần kinh - cơ khử cực.

Dạng thuốc và hàm lượng

Thuốc tiêm: 20 mg/ml; 50 mg/ml; 100 mg/ml.

Lọ thuốc bột pha tiêm: 50 mg; 100 mg.

Được lực học

Suxamethonium là thuốc chẹn thần kinh - cơ khử cực được sử dụng để làm giãn cơ. Các thuốc chẹn thần kinh - cơ khử cực cạnh tranh với acetylcholin ở thụ thể cholinergic tại bản vận động và cũng như acetylcholin, chúng gắn vào các thụ thể đó gây nên khử cực. Tuy nhiên, do ái lực cao với thụ thể cholinergic và tính kháng acetylcholinesterase, thuốc gây khử cực kéo dài hơn acetylcholin. Tác dụng này lúc đầu gây ra co cơ thoáng qua, thường thấy như giật bó cơ, sau đó ức chế dẫn truyền thần kinh - cơ. Kiểu chẹn thần kinh - cơ này không bị đối kháng, thậm chí có thể được tăng cường, bởi các thuốc kháng cholinesterase.

Dùng kéo dài hoặc nhắc lại các thuốc chẹn thần kinh - cơ khử cực có thể gây ra chẹn thần kinh - cơ giống như chẹn thần kinh - cơ không khử cực, dẫn đến suy hô hấp kéo dài hoặc ngừng thở.

Suxamethonium được dùng chủ yếu để gây giãn cơ trong các thủ thuật ngắn như đặt nội khí quản, nội soi, tiểu phẫu, liệu pháp gây sốc bằng điện hoặc bằng thuốc sau khi đã gây mê toàn thân. Suxamethonium là thuốc được chọn để giãn cơ xương trong thủ thuật chỉnh hình. Do thời gian tác dụng ngắn, suxamethonium thường là thuốc chẹn thần kinh - cơ khử cực được chọn cho thủ thuật kéo dài dưới 3 phút. Ngoài ra do thuốc bắt đầu tác dụng nhanh nên thích hợp cho tình trạng cấp cứu khi cần đặt nội khí quản nhanh. Thời gian tác dụng của suxamethonium có thể kéo dài bằng cách truyền tĩnh mạch liên tục hoặc chia thành liều nhỏ để tiêm.

Được động học

Suxamethonium có khởi đầu tác dụng nhanh và thời gian tác dụng ngắn. Sau khi tiêm tĩnh mạch 10 - 30 mg suxamethonium clorid, ở người lớn khỏe mạnh, tác dụng giãn cơ xuất hiện trong vòng

0,5 - 1 phút, kéo dài 2 - 6 phút và mất đi từ từ trong vòng 10 phút. Thời gian tác dụng sau khi tiêm tĩnh mạch một liều đơn được xác định bởi sự khuếch tán thuốc ra khỏi bán vận động hơn là sự đào thải của thuốc do bị enzym thủy phân. Tuy nhiên, sau khi đạt được nồng độ tương đối ổn định trong máu, nếu tiếp tục truyền tĩnh mạch hoặc tiêm nhiều liều, thời gian tác dụng ngắn của thuốc là do bị thủy phân nhanh. Sau tiêm bắp, tác dụng xuất hiện trong 2 - 3 phút và kéo dài 10 - 30 phút. Thời gian tác dụng kéo dài ở những người bệnh có nồng độ cholinesterase giả trong huyết tương thấp. Sau khi tiêm suxamethonium nhanh chóng bị thủy phân bởi cholinesterase trong huyết tương thành succinylmonocholin. Succinylmonocholin chỉ có hoạt tính bằng 1/20 hoạt tính của suxamethonium và gây ra chẹn thần kinh - cơ không khử cực hơn là khử cực. Succinylcholin sau đó bị thủy phân chậm thành cholin và acid succinic. Khoảng 10% suxamethonium đào thải ở dạng không đổi qua nước tiểu. Một lượng nhỏ thuốc qua hàng rào nhau thai. Gen quyết định sự biểu hiện của cholinesterase rất đa dạng và hoạt tính enzym thay đổi giữa các cá thể.

Chỉ định

Hỗ trợ gây mê toàn thân, tạo thuận lợi cho đặt nội khí quản, giãn cơ trong phẫu thuật hoặc thông khí cơ học (thở máy), giúp mềm cơ trong nắn xương gãy.

Chống chỉ định

Bản thân hoặc gia đình có tiền sử sốt cao ác tính, bệnh cơ kèm tăng creatin kinase huyết thanh (CK hoặc CPK), glôcôm góc đóng, chấn thương xuyên thấu mắt, người bị rối loạn di truyền cholinesterase huyết tương, người mẫn cảm với thuốc. Người bệnh mới bị bỏng nặng, đa chấn thương, cắt nhiều dây thần kinh cơ xương hoặc chấn thương neuron vận động ở vỏ não (neuron vỏ não), tăng kali huyết, suy gan.

Thận trọng

Phải rất thận trọng và giảm liều hoặc không dùng nếu người bệnh có nồng độ cholinesterase thấp bất thường, kể cả những người bệnh di truyền đồng hợp tử sản sinh cholinesterase không điển hình. Nếu nghi ngờ hoạt tính cholinesterase thấp, có thể dùng một liều nhỏ (5 - 10 mg) để thử hoặc có thể truyền tĩnh mạch thận trọng dung dịch 0,1% để gây giãn cơ. Ngừng thở hoặc liệt cơ kéo dài được điều trị bằng hô hấp chi huy. Dùng máu tươi toàn phần hoặc huyết tương có tác dụng phục hồi nồng độ cholinesterase.

Cũng cần thận trọng với những người bệnh mất cân bằng điện giải, người bệnh dùng quinidin hoặc glycosid tim hoặc nghi bị ngộ độc glycosid tim vì suxamethonium có thể gây loạn nhịp tim nặng hoặc ngừng tim ở các người bệnh này. Cần hết sức thận trọng hoặc không dùng đối với những người bệnh phẫu thuật mắt hoặc bị glôcôm. Thận trọng với những người bệnh vốn có tăng kali huyết hoặc liệt 2 chi dưới, người bị nhiễm khuẩn vùng bụng mạn tính, xuất huyết dưới màng nhện, thoái hóa hoặc loạn dưỡng thần kinh - cơ hoặc tình trạng gây ra thoái hóa hệ TKTW và ngoại vi, vì có thể xảy ra tăng kali huyết nặng. Phải thận trọng đối với người bệnh gãy xương hoặc cơ, vì giập bó cơ ban đầu có thể làm chấn thương nặng thêm.

Suxamethonium chỉ được sử dụng bởi người có kinh nghiệm trong xử trí hô hấp nhân tạo và khi có sẵn đầy đủ phương tiện hồi sức ngừng thở.

Thận trọng khi dùng thuốc cho trẻ em và thanh thiếu niên. Tiêu cơ vân cấp đi kèm tăng kali huyết, nhịp nhanh thất và ngừng tim đã được ghi nhận ở trẻ em không có bệnh lý về cơ.

Sử dụng thận trọng trên bệnh nhân bỏng nặng (bỏng sâu hoặc bỏng trên diện tích lớn), nguy cơ tăng kali huyết hoặc tình trạng kháng thuốc tăng lên sau tổn thương.

Thận trọng khi dùng thuốc trên người cao tuổi do tác dụng và thời

gian tác dụng của thuốc thay đổi nhiều hơn ở người cao tuổi.

Thận trọng khi sử dụng thuốc trên bệnh nhân có tiền sử phản ứng phản vệ do phản ứng phản vệ nặng đã được ghi nhận. Mẫn cảm chéo với các thuốc ức chế thần kinh cơ khác có thể xảy ra.

Thời kỳ mang thai

Nồng độ cholinesterase giảm trong khi mang thai và một vài ngày sau đẻ và phần lớn người mang thai nhạy cảm với suxamethonium. Suxamethonium có thể dùng để giãn cơ trong mổ đẻ. Mặc dù thuốc thường qua nhau thai với số lượng nhỏ nhưng tác dụng chẹn thần kinh cơ còn sót lại (ngừng thở, nhão cơ) có thể xảy ra cho trẻ sơ sinh khi người mẹ dùng thuốc nhiều lần với liều cao hoặc khi người mẹ có hoạt tính enzym cholinesterase không điển hình. Vì vậy, suxamethonium chỉ dùng cho phụ nữ mang thai khi thật cần thiết.

Thời kỳ cho con bú

Chưa biết thuốc có tiết vào sữa mẹ hay không. Cần thận trọng khi sử dụng cho phụ nữ trong thời kỳ cho con bú.

Tác dụng không mong muốn (ADR)

ADR chủ yếu là tác dụng dược lý quá mức của thuốc. Tác dụng chẹn thần kinh - cơ kết thúc do hoạt tính của cholinesterase và ngừng thở kéo dài có thể xảy ra ở những người bệnh có enzym này không điển hình hoặc có hoạt tính enzym thấp. Ngừng thở cũng có thể xảy ra do phát sinh giai đoạn chẹn II sau khi dùng liều cao hoặc nhắc lại. Suxamethonium có thể gây chậm nhịp tim thoáng qua kèm theo hạ huyết áp, loạn nhịp tim và có thể bị ngừng tim thời gian ngắn do tăng kích thích dây thần kinh phế vị, đặc biệt khi dùng thuốc nhắc lại và ở trẻ em. Các tác dụng tiếp theo như nhịp nhanh, tăng huyết áp có thể xảy ra do kích thích nhẹ hạch giao cảm.

Thường gặp

Mắt: tăng nhãn áp.

Tim mạch: nhịp chậm, nhịp tim nhanh, đỏ bừng da.

Tiêu hóa: tăng áp lực dạ dày.

Da: phát ban.

Cơ xương: rung giật cơ, đau cơ sau phẫu thuật, myoglobin trong máu, myoglobin trong nước tiểu.

Toàn thân: tăng tạm thời kali huyết.

Hiếm gặp

Tuần hoàn: loạn nhịp tim bao gồm nhịp nhanh thất, ngừng tim.

Hô hấp: cơ thất phế quản, ức chế hô hấp kéo dài, ngừng thở.

Cơ, xương: cứng hàm.

Miễn dịch: phản ứng phản vệ.

Toàn thân: sốt cao ác tính.

Hướng dẫn cách xử trí ADR

Nói chung, ở người lớn, tiêm một lần ≤ 30 mg suxamethonium clorid hoặc truyền tĩnh mạch 2,5 mg/phút gây ngừng thở thoáng qua, nhưng không gây liệt hô hấp hoàn toàn hoặc kéo dài. Hô hấp thường tự hồi phục sau vài giây hoặc tối đa sau 4 phút. Nếu hô hấp không tự hồi phục nhanh, cần hô hấp hỗ trợ có kiểm soát bằng oxygen. Truyền máu tươi toàn phần, hoặc huyết tương đông lạnh hoặc các nguồn cholinesterase khác, giúp phân hủy suxamethonium. Cần tránh tăng thông khí phổi vì sẽ gây ngừng thở kéo dài.

Tác dụng kiểu muscarin của suxamethonium như làm chậm nhịp tim, tăng tiết nước bọt, có thể ngăn chặn bằng cách dùng chất đối kháng muscarin như atropin trước khi dùng suxamethonium. Một liều nhỏ của một chất giãn cơ có cạnh tranh (với acetylcholin) đã được dùng trước khi tiêm suxamethonium để giảm một vài tác dụng có hại của suxamethonium nhưng kết quả hạn chế. Phản ứng quá mẫn nặng cần được điều trị nhanh chóng bằng các biện pháp hỗ trợ và điều trị triệu chứng.

Nếu có sốt cao ác tính thì cần ngừng dùng tất cả các thuốc gây mê

và tiến hành hạ nhiệt nhanh. Hô hấp bằng máy và các biện pháp hỗ trợ khác là cần thiết. Toan chuyển hóa cần phải được điều trị bằng cách tiêm tĩnh mạch nhanh dantrolen natri.

Liều lượng và cách dùng

Cách dùng: Suxamethonium thường tiêm tĩnh mạch. Đối với trẻ em hoặc người bệnh khó tiêm tĩnh mạch, thuốc có thể tiêm bắp sâu. Liều lượng phải được điều chỉnh cẩn thận, tùy theo mức độ giãn cơ, đường dùng và đáp ứng của từng người bệnh. Theo dõi chức năng thần kinh cơ trong quá trình truyền hoặc nếu tiêm với liều tích lũy lớn trong thời gian ngắn.

Người lớn

Với phẫu thuật ngắn: Tiêm tĩnh mạch 0,6 mg (khoảng 0,3 - 1,1 mg)/kg, tiêm trong vòng 10 - 30 giây. Có thể tiêm nhắc lại, liều tùy thuộc đáp ứng của liều đầu tiên.

Hoặc tiêm bắp 3 - 4 mg/kg, không quá tổng liều 150 mg.

Với phẫu thuật kéo dài: Tiêm tĩnh mạch 0,6 - 1,1 mg/kg. Liều tiếp theo tùy thuộc từng người bệnh, nhằm duy trì mức độ giãn cơ cần thiết. Không nên chia nhỏ liều và tiêm làm nhiều lần, vì có thể gây giảm nhanh tác dụng thuốc và ngừng thở kéo dài. Truyền tĩnh mạch liên tục được ưa dùng trong phẫu thuật kéo dài.

Truyền tĩnh mạch dung dịch 0,1 - 0,2% trong dung dịch glucose 5% hoặc natri clorid 0,9% hoặc các dung dịch tiêm truyền thích hợp khác, với tốc độ 500 microgam (0,5 mg) - 10 mg/phút; tùy theo đáp ứng của người bệnh và mức độ giãn cơ cần thiết, thời gian truyền có thể tới 1 giờ. Khi truyền tĩnh mạch, cần theo dõi mức giãn cơ bằng máy kích thích thần kinh ngoại vi để tránh quá liều và để phát hiện tác dụng chẹn thần kinh - cơ không khử cực.

Trẻ em

Đặt nội khí quản: Liều tiêm bắp lên tới 2,5 mg/kg, nhưng không vượt quá tổng liều 150 mg. Tiêm tĩnh mạch 1 - 2 mg/kg.

Có thể tiêm nhắc lại nếu cần thiết, liều nhắc lại dựa trên đáp ứng của người bệnh với liều tiêm đầu tiên. Truyền tĩnh mạch liên tục không an toàn cho trẻ sơ sinh và trẻ em vì nguy cơ sốt cao ác tính.

Nhận xét

Đề đánh giá khả năng chuyển hóa suxamethonium của người bệnh, có thể dùng liều thử 0,1 mg/kg với người bệnh thờ tự nhiên sau khi mê. Những người có chuyển hóa suxamethonium bình thường, hiếm khi xảy ra ức chế hô hấp và nếu có xảy ra thì thường ngắn và hết sau ít hơn 5 phút. Người bệnh không có khả năng chuyển hóa thuốc sẽ bị liệt, dù đề tiến hành đặt nội khí quản và thường hồi phục sau 30 - 60 phút.

Người cao tuổi: Dùng liều tương tự người lớn. Người cao tuổi dễ bị rối loạn nhịp tim hơn đặc biệt khi các thuốc kiểu digitalis cũng được sử dụng, do vậy cần thận trọng.

Bệnh nhân suy giảm chức năng thận: Có thể dùng liều đơn thông thường cho bệnh nhân suy thận không có tăng kali huyết. Tránh dùng liều lớn hoặc đa liều do có thể làm tăng có ý nghĩa kali huyết.

Bệnh nhân suy gan: Cần thận trọng đặc biệt đối với suy gan giai đoạn cuối (tăng nguy cơ ngừng thở kéo dài do giảm tổng hợp cholinesterase ở gan).

Bệnh nhân giảm cholinesterase huyết: Cần giảm liều suxamethonium.

Tương tác thuốc

Các thuốc hoặc hóa chất được biết làm giảm hoạt tính cholinesterase huyết tương có thể kéo dài tác dụng ức chế thần kinh cơ của suxamethonium: phospho hữu cơ, metrifonat, thuốc nhỏ mắt có chứa ecothiophat, trimetaphan, các thuốc kháng cholinesterase như neostigmin, pyridostigmin, physostigmin, edrophonium, tacrin hydroclorid; các thuốc gây độc tế bào như cyclophosphamid, meclorethamin, triethylen-melamin và thiotepea; các thuốc tác dụng

trên tâm thần như phenelzin, promazin và clorpromazin; các thuốc gây mê như ketamin, morphin, các thuốc đối kháng với morphin, pethidin, pancuronium, propanidid; các thuốc ức chế thu hồi chọn lọc serotonin.

Các thuốc có tiềm năng làm giảm hoạt tính cholinesterase huyết tương bao gồm aprotinin, diphenhydramin, promethazin, oestrogen, oxytocin, liều cao các steroid, thuốc tránh thai đường uống, terbutalin và metoclopramid.

Các thuốc hoặc các chất có thể tăng cường hoặc kéo dài tác dụng của suxamethonium theo cơ chế không liên quan đến hoạt tính cholinesterase: Muối magesi, lithi carbonat, azathioprin, quinin, cloroquin, các thuốc kháng sinh như các aminoglycosid, clindamycin và polymyxin, các thuốc chống loạn nhịp như: quinidin, procainamid, verapamil, các thuốc chẹn beta, lidocain và procain, các thuốc gây mê đường hô hấp như: halothan, enfluran, desfluran, isofluran, diethylether và methoxyfluran.

Bệnh nhân đang dùng các thuốc tương tự digitalis nhạy cảm hơn với ảnh hưởng tăng kali huyết của suxamethonium.

Tương kỵ

Suxamethonium nhanh chóng bị thủy phân, mất tác dụng nhanh và có thể kết tủa khi trộn với các dung dịch kiềm hoặc các thuốc khác. Vì vậy, suxamethonium không được trộn trong cùng bơm tiêm hoặc dùng cùng kim tiêm với các barbiturat tác dụng ngắn như thiopental natri hoặc các thuốc khác có tính kiềm.

Quá liều và xử trí

Triệu chứng: Kéo dài tác dụng chẹn thần kinh - cơ, yếu cơ xương, giảm dự trữ hô hấp, giảm thể tích thông khí, ngừng thở quá thời gian phẫu thuật hoặc gây mê.

Xử trí: Duy trì hô hấp đầy đủ và làm hô hấp nhân tạo hoặc cho thở máy cho đến khi bão đảm hồi phục hô hấp bình thường. Tác dụng chẹn thần kinh - cơ không khử cực do suxamethonium không bị các thuốc kháng cholinesterase đối kháng. Tuy nhiên nếu chẹn thần kinh - cơ không khử cực chuyển dần sang chẹn thần kinh - cơ khử cực, thì có thể trung hòa bằng các liều nhỏ thuốc kháng cholinesterase. Atropin được dùng trước hoặc đồng thời với chất đối kháng để làm mất tác dụng phụ cholinergic của nó. Người bệnh cần được theo dõi sát ít nhất 1 giờ sau khi tác dụng chẹn thần kinh - cơ không khử cực đã hết để tránh giãn cơ thứ phát.

Cập nhật lần cuối: 2017.

TACROLIMUS

Tên chung quốc tế: Tacrolimus.

Mã ATC: D11AH01, L04AD02.

Loại thuốc: Thuốc ức chế miễn dịch.

Dạng thuốc và hàm lượng

Viên nang: 0,5 mg, 0,75 mg, 1 mg, 2 mg, 5 mg.

Viên nang giải phóng kéo dài: 0,5 mg, 1 mg, 3 mg, 4 mg, 5 mg.

Viên nén giải phóng kéo dài: 0,75 mg, 1 mg, 4 mg.

Cốm pha hỗn dịch: 0,2 mg, 1 mg.

Dung dịch pha truyền: 5 mg/ml.

Thuốc mỡ: 0,03%; 0,1%.

Được lực học

Tacrolimus là một macrolid (macrolactam) chiết xuất từ *Streptomyces tsukubaensis* có tác dụng ức chế miễn dịch. Tacrolimus gắn với một protein nội bào là FKBP-12 với ái lực cao, tạo thành một phức hợp. Phức hợp này có khả năng gắn với calcineurin, một phosphatase hoạt động phụ thuộc vào calci và calmodulin, và ức chế hoạt động của enzym này. Quá trình này có