



ایماتینیب

ترکیب:

هر قرص روکش دار حاوی ۴۰۰ میلی گرم ایماتینیب (به صورت مزینات) می باشد.

توصیف:

ایماتینیب مهارکننده انتخابی تیروزین کیناز Bcr-Abl و یک آنتی نئوپلاست است. تیروزین کیناز Bcr-Abl، تیروزین کیناز غیر نرمالی است که از کروموزوم فیلادلفیا ایجاد می شود و فعالیت بیشتری نسبت به تیروزین کیناز عادی دارد.

ایماتینیب بصورت رقابتی روی گیرنده ها جایگاه ATP، تیروزین کیناز Bcr-Abl می نشیند و از تحریک سلولی جلوگیری می کند. این دارو با سلول های لوسمی ph در CML اولیه موتاسیون یافته و مقاوم به ایماتینیب مقابله می کند.

ایماتینیب همچنین C-kit، PDGF، و قیام سلولی مرتبط به PDGF را مهار می کند.

فارماکوکینتیک

جذب: فراهمی زیستی: ۹۸٪

حداکثر غلظت پلاسمایی: ۲-۴ ساعت

توزیع: پروتئین باندینگ: ۹۵٪

متابولیسم:

اکسیداسیون و هیدرواکسیداسیون کبدی با CYP3A4
مهارکننده های آنزیمی: CYP3A4, CYP2C8, CYP2C9, CYP2D6, UGT1A1
الفاکننده آنزیمی: CYP2B6, CYP2C8, CYP2C9

حذف: نیمه عمر: ۱۸ ساعت (دارو)، ۴۰ ساعت (متابولیت)

کلیرانس: ۸-۱۴ L/hr

دفع: تقریباً ۸۱٪ (۶۸٪ مدفوع و ۱۳٪ ادرار) در طی ۷ روز از بدن حذف می شود.

قابلیت دیالیز: ندارد.

دوزاژ و نحوه مصرف

بزرگسالان

۱. لوسمی لیمفوبلاستیک حاد

۶۰۰ میلی گرم روزانه

۲. ماستوسیتوزیس و ماستوسیتوزیس همراه با انژیوتوفیلی

• بدون جهش D816V c-kit: ۴۰۰ میلی گرم روزانه

• در جهش های ناشناخته C-kit درمان با ۱۰۰ میلی گرم روزانه شروع و در صورت نیاز به ۴۰۰ میلی گرم افزایش یابد.

۳. لوسمی میلوئیدی مزمن

• در فاز تسریع شده و بحرانی

دوز دارو در این فاز از ۶۰۰ میلی گرم روزانه شروع می شود و تا ۴۰۰ میلی گرم هر ۱۲ ساعت افزایش می یابد.

• در فاز مزمن

دوز دارو در این فاز از ۴۰۰ میلی گرم روزانه شروع می شود و تا ۶۰۰ میلی گرم تک دوز و یا ۴۰۰ میلی گرم هر ۱۲ ساعت افزایش می یابد.

۴. تورم درماتوفیبروسارکوما

۴۰۰ میلی گرم هر ۱۲ ساعت

۵. تومور استرومال دستگاه گوارش

۴۰۰ میلی گرم روزانه

۶. سندرم پیشرفته هایپراتنوزیوفیلی و لوسمی مزمن انژیوتوفیلی

دوز دارو در این فاز از ۱۰۰ میلی گرم روزانه شروع می شود و تا ۴۰۰ میلی گرم افزایش می یابد.

۷. میلودیسپلاستیک / بیماری میلوپروولیفراتیو

۴۰۰ میلی گرم روزانه

کودکان

۱. لوسمی مزمن میلوئیدی

در کودکان زیر ۱ سال تجویز نمی شود.

در کودکان ۱ سال و بالاتر ۳۴۰mg/m²/day از ۶۰۰ میلی گرم روزانه بیشتر نشود.

۲. لوسمی لنفوبلاستیک حاد

در کودکان زیر ۱ سال تجویز نمی شود.

در کودکان ۱ سال و بالاتر ۳۴۰mg/m²/day از ۶۰۰ میلی گرم روزانه بیشتر نشود.

تعدیل دوز:

۱. اگر احتیاس مایع باشد، درمان قطع شود.

۲. سمیت خونی

• در طول درمان اگر ANC < 1000/mm³ و plt < 50000/mm³ مصرف دارو قطع می گردد ولی اگر ANC > 1500/mm³ و plt > 75000/mm³ باشد، مجدداً درمان را شروع می کنیم.

۳. سمیت کبدی

• در طول درمان اگر BIL > 3ULN و یا ALT/AST > 5ULN باشد، مصرف دارو قطع می گردد ولی اگر BIL < 1.5ULN و یا ALT/AST < 2.5ULN شود، مجدداً مصرف دارو با کمترین دوز شروع می شود.

مانیتورینگ

ماه اول هر هفته و سپس ماه دوم هر دو هفته و سپس بصورت دوره ای CBC چک شود. LFT در شروع درمان و ماهانه چک شود.

نشانه های احتیاس مایع

بررسی مشکلات گوارشی، قلبی، کلیوی

بررسی تیروئید در بیمارانی که تحت درمان با لووتیروکسین هستند.

رشد کودکانی که تحت درمان با ایماتینیب هستند.

احتیاطات

مشکلات کبدی، افراد مسن، استفاده از القا کننده های قوی CYP3A4 و مهار کننده های CYP2C9، 2D6، 3A4، احتیاس مایع، سمیت کبدی و خونی، مشکلات قلبی، خونریزی گوارشی، پرکاری تیروئید، مشکلات کلیوی.

منع مصرف

در ازدیاد حساسیت به هر ترکیب ایماتینیب

عوارض جانبی

ادم، تهوع، دردهای عضلانی، راش، خستگی، میالژیا، شکم درد، تب، افزایش وزن، سمیت کبدی، بیخوابی

توصیه به بیمار

دارو را همراه با غذا با آب زیاد میل کنید.

برای بیماران که قادر به بلع نیستند قرص روکش دار را در آب یا آبمیوه حل کنید.

درمان باید تا زمانی که هیچ علامتی از پیشرفت بیماری و یا سمیت قابل توجه وجود نداشته باشد ادامه یابد. در صورت مشاهده هر گونه عوارض از قبیل شکم درد، تهوع و استفراغ، سردرد، درد عضلانی، دوبینی و تشدید عوارض حتماً با پزشک و یا داروساز خود مشورت کنید.

این دارو ایمنی بدن را در برابر عفونت ها کاهش می دهد، در صورت مشاهده هر گونه نشانه عفونت با پزشک خود در میان بگذارید.

حساسیت شدید به این دارو بسیار نادر است، در صورت رویت نشانه های آلرژی مانند راش، التهاب، خارش مخصوصاً در زبان و صورت و گلو، مشکلات تنفسی سریعاً به بیمارستان مراجعه کنید.

قبل از مصرف دارو هر گونه حساسیت به ایماتینیب و یا اجزا آن را با پزشک خود در میان بگذارید.

قبل از مصرف دارو هر گونه بیماری زمینه ای شامل مشکلات خونی، مشکلات قلبی، نارسایی کلیوی و کبدی و برداشتن تیروئید را به پزشک خود اطلاع دهید.

در حین مصرف این دارو از رانندگی و کارهایی که به دقت بالا نیاز دارد بپرهیزید، این دارو باعث خواب آلودگی و دوبینی می شود.

بدون مشورت پزشک معالج اقدام به واکسیناسیون نکنید.

قبل از انجام هر گونه جراحی پزشک معالج خود را از مصرف ایماتینیب آگاه کنید.

این دارو احتمال کند کردن رشد کودکان را ایجاد می کند رشد کودک به صورت مرتب مورد ارزیابی قرار گیرد. بزرگسالان به عوارض جانبی مخصوصاً ادم حساسیت بیشتری نشان می دهند.

چون این دارو جذب پوستی و تنفسی دارد و برای جنین تراژون است، زنان باردار و یا کسانی که قصد بارداری دارند نباید به این دارو دست بزنند و یان را استشمام کنند.

مصرف بیش از حد دارو

اگر به مسمومیت بخاطر مصرف بیش از حد دارو مشکوک هستید، سریعاً به پزشک خود مراجعه نمایید.

دوز فراموش شده

اگر یک دوز دارو فراموش شود، دارو را در دوز بعدی دو برابر نکنید و دوز بعدی را مانند قبل مصرف نمایید.

بارداری و شیردهی

رده بارداری: D

در شیر ترشح می شود و نباید مصرف شود.

نحوه نگهداری

دور از نور و رطوبت نگهداری شود.

در دمای زیر ۳۰ درجه سانتی گراد نگهداری شود.

دور از دسترس کودکان قرار دهید.

مطابق دستورالعمل داروهای سایتوتوکسیک حمل و نگهداری و معدوم گردد.

شکل دارویی ایماتینیب

قوطی حاوی ۳۰ قرص روکش دار

منابع:

کتاب drug fact ویرایش ۲۰۱۵، قسمت مهارکننده تیروزین کیناز، صفحه ۳۷۷۱-۳۷۸۴
کتاب BNF۶۸، قسمت ۱-۸ داروهای آنتی نئوپلاستیک، صفحات ۵۹۷-۵۹۸

ساخت شرکت:

نواوران دارویی کیمیا، تهران، ایران

تلفکس: ۸۸۰۱۲۹۴۶ - ۰۲۱