

clobetasol, phải kết hợp dùng thuốc kháng sinh hoặc thuốc kháng nấm thích hợp. Nếu nhiễm khuẩn, nhiễm nấm không kiểm soát được ngay, phải ngừng clobetasol cho đến khi đã kiểm soát được nhiễm khuẩn, nhiễm nấm. Nhiều dạng thuốc clobetasol propionat có thêm kháng sinh như neomycin và kháng nấm như nystatin.

Khi dùng clobetasol propionat dạng bột, kem, nếu bị kích ứng, phải ngừng clobetasol và thay bằng thuốc thích hợp khác. Dạng bột dễ cháy, phải tránh đùng gần lửa hoặc hút thuốc trong và ngay sau khi bôi thuốc.

Thời kỳ mang thai

Tiêm dưới da clobetasol propionat liều 0,05 mg/kg/ngày cho chuột và thỏ gây tiêu thai và gây quái thai. Dị dạng thai thường biểu hiện bằng biến dạng hệ xương và khe hở vòm miệng.

Chưa có đủ số liệu nghiên cứu tác dụng trên thai ở người mang thai bôi clobetasol propionat. Tuy nhiên, thuốc có thể hấp thu qua da. Nên cân nhắc giữa lợi ích cho mẹ và nguy cơ cho thai. Nếu thật cần thiết phải dùng, không nên dùng liều cao và thời gian kéo dài.

Thời kỳ cho con bú

Dùng corticosteroid toàn thân, thuốc có thể qua sữa mẹ, làm chậm sự phát triển của trẻ bú mẹ, ảnh hưởng đến sự sản xuất glucocorticoid nội sinh và gây ra nhiều tai biến khác. Chưa có nghiên cứu trên phụ nữ nuôi con bú dùng thuốc bôi ngoài để đánh giá thuốc có vào sữa mẹ với số lượng đủ gây độc hại cho trẻ hay không. Nếu bôi nhiều và dùng lâu thì không nên cho con bú.

Tác dụng không mong muốn (ADR)

Thường gặp

Bong rộp, đau nhói như bị côn trùng đốt, ngứa.

Ít gặp

Teo da, rạn nứt da, giãn mạch.

Hiếm gặp

Da: mồng da, khô da, rậm lông, vảy nến mũ, ban da, mày đay, xuất hiện kiểu trứng cá - hạt kê ở da, giảm sắc tố da, viêm da quanh miệng, viêm da tiếp xúc dị ứng.

Chuyển hóa: Tai biến quan trọng nhất là sau khi bôi, nếu thuốc hấp thu nhiều qua da vào tuần hoàn sẽ ức chế trục dưới đồi - tuyến yên - thượng thận, gây suy thượng thận, hội chứng giả Cushing, tăng glucose huyết và glucose niệu ở một số người bệnh.

Hướng dẫn cách xử trí ADR

Để tránh suy thượng thận, khi dùng lâu và bôi trên diện rộng (dùng liều cao), cần đánh giá chức năng thượng thận vì có thể bị ức chế trục dưới đồi - tuyến yên - thượng thận (trục HPA), bằng các nghiệm pháp như nghiệm pháp kích thích bằng ACTH, định lượng cortisol trong huyết tương và cortisol tự do trong nước tiểu. Nếu thấy có biểu hiện suy thượng thận, phải cố gắng thử ngừng thuốc, phải giảm số lần bôi, hoặc thay bằng một glucocorticoid có hoạt tính thấp hơn. Khi ngừng thuốc, chức năng trục HPA thường hồi phục nhanh và hoàn toàn, nhưng nếu thấy có biểu hiện thiếu glucocorticoid, phải bổ sung bằng cách uống corticosteroid.

Liều lượng và cách dùng

Bôi một lớp mỏng kem, mỡ, gel, thuốc xức hoặc bột clobetasol propionat và xoa nhẹ lên vùng da bị bệnh, ngày 2 lần vào sáng và chiều tối.

Nếu bị bệnh ở da đầu, nên ưu tiên dùng dạng thuốc bột. Lộn ngược ống thuốc, bóp nhẹ để thuốc vào chỗ bị bệnh. Không nên dùng tay lấy thuốc, vì bột thuốc sẽ tan ngay khi tiếp xúc với da ẩm. Vén tóc ra khỏi vùng bị bệnh để bôi thuốc đúng vào vùng cần điều trị. Sau đó, xoa nhẹ vào vùng da đầu có thuốc, cho đến khi hết. Dùng ngày 2 lần, sáng và chiều tối. Bôi thuốc xong, nên để hở, chỉ băng kín lại nếu có chỉ định của thầy thuốc.

Dạng thuốc gội đầu: Thoa trực tiếp lên da đầu khô mỗi ngày một

lần 1 lớp mỏng trên vùng da đầu bị bệnh và để khoảng 15 phút trước khi xả kỹ lại bằng nước và/hoặc dầu gội thông thường.

Thuốc tác dụng rất mạnh, vì vậy chỉ bôi một lượng vừa đủ lên chỗ bị bệnh, không nên dùng quá 2 g một lần. Nếu chỗ bị bệnh quá lớn, cũng không được dùng quá 50 g (50 ml) mỗi tuần và không nên dùng quá 2 tuần. Khi triệu chứng cải thiện, nên giảm tần suất dùng thuốc hoặc đổi sang loại corticoid có hoạt tính yếu hơn. Có thể tiếp tục dùng thêm 2 tuần nữa nếu tình trạng vẫn không cải thiện nhưng phải đánh giá nguy cơ và theo dõi thường xuyên sự ức chế trục dưới đồi - tuyến yên - thượng thận. Nếu dùng thuốc được 4 tuần mà không thấy có đáp ứng, phải ngừng thuốc và xem lại việc chẩn đoán.

Do clobetasol propionat có nhiều dạng dùng tại chỗ khác nhau, mỗi dạng lại có thể có những đặc điểm riêng tùy theo nhà sản xuất, cần đọc kỹ và làm theo đúng như tờ hướng dẫn sử dụng thuốc đính kèm với mỗi sản phẩm thuốc.

Liều cho trẻ em trên 1 tuổi: Tương tự như người lớn, bôi một lớp mỏng 1 - 2 lần/ngày, tối đa 4 tuần.

Tương tác thuốc

Dùng đồng thời thuốc bôi clobetasol propionat và thuốc corticosteroid khác (uống, tiêm hoặc xịt mũi) dễ làm tăng nguy cơ quá liều glucocorticoid dẫn đến ức chế trục dưới đồi - tuyến yên - thượng thận.

Tương kỵ

Thuốc dễ bị bắt lửa, nhất là dạng thuốc bột, tránh dùng gần nơi có ngọn lửa, hoặc bật lửa hút thuốc trong và ngay sau khi bôi thuốc.

Quá liều và xử trí

Dùng quá liều làm tăng hấp thu qua da vào tuần hoàn; nếu đủ lượng sẽ gây tai biến toàn thân, đặc biệt là suy thượng thận, hội chứng giả Cushing, tăng glucose huyết, glucose niệu.

Xử trí: Ngừng thuốc, chức năng trục dưới đồi - tuyến yên - thượng thận thường phục hồi nhanh. Nhưng đôi khi sau ngừng thuốc có biểu hiện thiếu glucocorticoid, phải dùng corticosteroid một thời gian; tùy trường hợp mà dùng loại hoạt tính trung bình hoặc mạnh.

Cập nhật lần cuối: 2021.

CLOFAZIMIN

Tên chung quốc tế: Clofazimine.

Mã ATC: J04BA01.

Loại thuốc: Thuốc trị phong và một số bệnh do Mycobacteria.

Dạng thuốc và hàm lượng

Nang: 50 mg, 100 mg.

Được lực học

Clofazimin thuộc nhóm thuốc nhuộm phenazin, có tác dụng chống viêm và chống *Mycobacterium*, bao gồm: *M. leprae*, *M. tuberculosis*, *M. avium* complex (MAC), *M. bovis*, *M. chelonae*, *M. fortuitum*, *M. kansasii*, *M. scrofulaceum*, *M. simiae*, *M. ulcerans*. *In vivo*, clofazimin có tác dụng diệt khuẩn chậm đối với vi khuẩn gây bệnh phong *Mycobacterium leprae*, tuy nhiên, khó đánh giá tác dụng của thuốc trên vi khuẩn, vì chưa thể nuôi cấy được *M. leprae in vitro*. Clofazimin có tác dụng diệt khuẩn đối với *M. tuberculosis* và *M. marinum in vitro*, nhưng chỉ có tác dụng kìm khuẩn đối với các *Mycobacterium* khác bao gồm *M. avium* complex (MAC).

In vitro, *Mycobacterium tuberculosis*, *M. bovis*, *M. ulcerans* thường bị ức chế ở nồng độ clofazimin 0,01 - 3,3 microgam/ml và *M. kansasii*, *M. marinum* bị ức chế bởi nồng độ clofazimin 0,15 - 6,4 microgam/ml.

Clofazimin có tác dụng chống viêm và miễn dịch cả *in vitro* và *in vivo*, tuy cơ chế chính xác của các tác dụng đó chưa được biết đầy đủ. *In vitro*, clofazimin ức chế sự di chuyển bạch cầu trung tính (sự ức chế này tăng dần lên và phụ thuộc liều dùng) và ức chế sự chuyển dạng lympho bào do ức chế mitogen. Tác dụng chống viêm và ức chế miễn dịch của clofazimin cùng với tác dụng chống *Mycobacterium* đóng góp rõ ràng vào hiệu quả của thuốc trong điều trị bệnh phong và hồng ban nút do phong.

Cơ chế tác dụng của clofazimin trên *Mycobacterium* chưa được biết rõ. Thuốc liên kết ưu tiên với DNA vi khuẩn và ức chế phát triển của *Mycobacterium*. Clofazimin gắn với DNA chủ yếu tại chuỗi base có chứa guanin, thuốc gắn ưu tiên với DNA của *Mycobacterium* do tỷ lệ guanin và cystein trong DNA này tương đối cao so với DNA của người. Cơ chế kháng khuẩn của clofazimin được giải thích thông qua tác dụng trực tiếp trên màng bằng tác động vào chuỗi hô hấp và vận chuyển ion qua màng của vi khuẩn. Clofazimin tác động vào chu trình oxy hóa khử nội bào, tạo ra các chất có oxy có hoạt tính kháng khuẩn (ROS), superoxid hydrogen peroxid (H_2O_2). Thêm vào đó, clofazimin tương tác với phospholipid màng tạo ra lysophospholipid kháng khuẩn làm cho rối loạn chức năng màng, dẫn tới rối loạn hấp thu K^+ vào tế bào. Cả 2 cơ chế trên làm rối loạn chuyển hóa năng lượng của tế bào vi khuẩn thông qua ngăn chặn quá trình tạo ATP tế bào vi khuẩn.

Cơ chế chống viêm của clofazimin chủ yếu thông qua ức chế sự hoạt hóa và tăng sinh của lympho T bằng cách thúc đẩy giải phóng ROS và các prostaglandin E, đặc biệt là PGE2 từ tế bào bạch cầu trung tính và bạch cầu mono.

M. leprae đề kháng với clofazimin nhưng hiếm gặp. Cho đến nay, kháng chéo giữa clofazimin với rifampicin hay dapson vẫn chưa được ghi nhận. Tuy nhiên có trường hợp được ghi nhận *M. leprae* kháng với clofazimin và dapson nhưng nhạy cảm với rifampicin.

Dược động học

Clofazimin được hấp thu khoảng 20 - 70% qua đường tiêu hóa sau khi uống. Sinh khả dụng thay đổi nhiều giữa các cá thể và phụ thuộc vào nhiều yếu tố như kích thước tiêu phân, dạng thuốc, liều dùng và có hay không có thức ăn trong đường tiêu hóa. Sự có mặt của thức ăn trong đường tiêu hóa có thể làm tăng tốc độ và mức độ hấp thu. Nếu uống clofazimin khi ăn no với bữa ăn có mỡ và protein, AUC tăng lên 60% và C_{max} tăng 30%, thời gian đạt T_{max} giảm từ 12 giờ xuống 8 giờ, so với uống thuốc lúc đói.

Người khỏe mạnh uống một liều 200 mg clofazimin, C_{max} đạt được sau 4 - 12 giờ. Kết quả nghiên cứu uống nhiều liều cho thấy chỉ có thể đạt được nồng độ thuốc ổn định trong huyết tương sau ít nhất 30 ngày điều trị. Người bệnh phong uống clofazimin liều 100 hoặc 300 mg một lần hàng ngày, nồng độ trung bình ổn định trong huyết tương tương ứng là 0,7 hoặc 1 microgam/ml. Tuy nhiên, mối quan hệ giữa nồng độ clofazimin và tác dụng điều trị của thuốc vẫn chưa được xác định.

Clofazimin có tính thân mỡ cao, nên được phân bố chủ yếu vào mô mỡ và tế bào hệ lưới nội mô; thuốc còn vào được đại thực bào. Ở bệnh nhân phong, khi uống clofazimin, thuốc phân bố và tích lũy dạng tinh thể với nồng độ cao nhất ở hạch bạch huyết mạc treo ruột, các mô mỡ, tuyến thượng thận, gan, túi mật, mật, lách và nồng độ thấp hơn ở da, ruột non, phổi, tim, thận, tụy, cơ, xương. Tinh thể clofazimin cũng tìm thấy ở tủy xương, đờm, mồ hôi, giác mạc, móng mắt, kết mạc. Clofazimin không vào trong não và dịch não tủy.

Thuốc qua nhau thai, tiết được vào sữa.

Cho đến nay sự chuyển hóa của clofazimin chưa được biết rõ ràng, tuy nhiên đã tìm thấy ít nhất 3 chất chuyển hóa trong nước tiểu ở người dùng clofazimin liều nhắc lại.

Sau khi uống một liều đơn clofazimin, nửa đời thải trừ khoảng 8

ngày. Sau khi uống nhiều liều, nửa đời trong mô của thuốc ít nhất là 70 ngày. Thuốc tồn tại trong các mô của cơ thể trong thời gian dài và thải trừ rất chậm. Clofazimin được tìm thấy trong da và hạch bạch huyết mạc treo ruột tương ứng là 2 và 4 năm sau khi đã ngừng dùng thuốc. Clofazimin được bài tiết chủ yếu dưới dạng không đổi qua phân, cả phần không hấp thu và phần đã thải trừ qua mật. Thuốc chỉ bài tiết qua nước tiểu với lượng nhỏ. Một lượng nhỏ được bài tiết qua tuyến bã nhờn và tuyến mồ hôi.

Chỉ định

Bệnh phong: Thể nhiều vi khuẩn; thể ít vi khuẩn nhưng không dung nạp dapson; phong u có phản ứng hồng ban nút.

Bệnh phổi và ngoài phổi do nhiễm *M. avium* complex (MAC) cho bệnh nhân không dung nạp với các thuốc chống lao hàng 1 và nhiễm chủng MAC kháng macrolid.

Bệnh lao đa kháng thuốc, lao siêu kháng thuốc: Theo Hướng dẫn của Chương trình Chống lao Quốc gia sử dụng clofazimin trong phác đồ phối hợp với các thuốc chống lao khác.

Chống chỉ định

Mẫn cảm với clofazimin.

Thận trọng

Thận trọng với người bệnh có triệu chứng tiêu hóa như đau bụng, ỉa chảy. Nếu người bệnh bị đau bụng nóng rát, buồn nôn, nôn, ỉa chảy khi điều trị bằng clofazimin, thì nên giảm liều và nếu cần, tăng khoảng cách thời gian uống thuốc hoặc ngừng thuốc.

Sử dụng thận trọng ở người có khoảng QT kéo dài, có thể dẫn tới xoắn đỉnh, đặc biệt là khi sử dụng với liều > 100 mg/ngày hoặc phối hợp với các thuốc có nguy cơ gây QT kéo dài. Cần theo dõi điện tâm đồ để phát hiện QT kéo dài và các rối loạn nhịp tim ở bệnh nhân sử dụng clofazimin. Khi sử dụng clofazimin phối hợp với bedaquilin, nếu thấy rối loạn nhịp thất có ý nghĩa trên lâm sàng hoặc khoảng QT \geq 500 ms cần ngừng thuốc clofazimin.

An toàn và hiệu quả của clofazimin ở trẻ em dưới 12 tuổi chưa được xác định. Thuốc đã được dùng cho một số ít trẻ em.

Người bệnh dùng clofazimin phải được thông báo thuốc có thể gây đổi màu từ hồng sang nâu đen ở da cũng như ở kết mạc, nước mắt, mồ hôi, đờm, nước tiểu, phân, nước mũi, tinh dịch và sữa. Phải khuyên người bệnh là hiện tượng đổi màu da tuy có hồi phục nhưng có thể phải mất vài tháng hoặc vài năm sau khi ngừng dùng clofazimin.

Sử dụng thận trọng trên người bị suy gan, thận, người mang thai và thời kỳ cho con bú.

Khi cần sử dụng với liều hàng ngày vượt quá 100 mg, chỉ nên dùng trong thời gian ngắn nhất có thể và dưới sự giám sát của thầy thuốc. Sử dụng clofazimin ở người cao tuổi cần thận trọng trong lựa chọn liều, thường khởi đầu bằng liều thấp nhất trong khoảng liều khuyến cáo và lưu tâm tới những bệnh phối hợp cũng như suy giảm chức năng tim, gan, thận ở người cao tuổi.

Thời kỳ mang thai

Clofazimin qua hàng rào nhau thai. Mẹ mang thai dùng clofazimin có thể làm đổi màu da của trẻ mới sinh. Da đổi màu nhạt dần trong năm đầu. Một vài trẻ sơ sinh đã tử vong khi mẹ dùng thuốc trong thời kỳ mang thai, nhưng liên quan nhân quả với clofazimin chưa được xác định. Do đó, thuốc chỉ dùng cho người mang thai khi xét thấy lợi ích lớn hơn nguy cơ có thể có cho thai nhi.

Thời kỳ cho con bú

Clofazimin bài tiết vào sữa mẹ với tỷ lệ cao so với liều dùng của người mẹ (khoảng 30% liều dùng của mẹ tiết vào trong sữa) và làm cho da của trẻ bú mẹ bị sẫm màu. Do vậy chỉ dùng clofazimin cho người mẹ cho con bú khi cân nhắc chỉ định rõ ràng.

Tác dụng không mong muốn (ADR)

Clofazimin dung nạp tốt ở liều 100 mg hàng ngày hoặc thấp hơn. Những phản ứng có hại thường gặp chủ yếu ở da, mắt và đường tiêu hóa.

Thường gặp

Da: Thay đổi màu da từ hồng sang nâu đen (75 - 100% bệnh nhân dùng clofazimin) mức độ đổi màu da liên quan đến liều, vảy cá, khô da, nổi ban, ngứa.

Mắt: Đổi màu kết mạc, khô mắt, ngứa mắt, bị kích thích, chảy nước mắt.

Tiêu hóa: Rối loạn tiêu hóa gặp ở 60% bệnh nhân dùng clofazimin và liên quan liều dùng: nôn, buồn nôn, ỉa chảy, hoặc táo bón, đau bụng, chảy máu tiêu hóa.

Phản ứng khác: tăng nồng độ glucose, albumin, bilirubin trong máu; đờm, dịch tiết mũi xoang, mồ hôi sữa, phân, tinh dịch và nước tiểu đổi màu; tăng bạch cầu ái toan, thiếu máu, giảm kali huyết.

Ít gặp

Tim mạch: phù, đau mạch.

TKTW: chóng mặt, choáng váng, hoa mắt, buồn ngủ, mệt mỏi, đau đầu, rối loạn vị giác. Trầm cảm có thể dẫn tới tự tử.

Tiêu hóa: tắc ruột, chảy máu đường tiêu hóa, chán ăn, táo bón, sút cân.

Gan: viêm gan, vàng da, tăng albumin, bilirubin và AST trong huyết thanh.

Liều lượng và cách dùng

Cách dùng: Clofazimin dùng theo đường uống và nên uống vào bữa ăn để hấp thu thuốc tối đa.

Điều trị phong thể nhiều vi khuẩn (có hơn 5 tổn thương): Liều cho người lớn clofazimin (50 mg một lần hàng ngày, cộng thêm liều 300 mg một lần hàng tháng), dapson (100 mg một lần hàng ngày) và rifampin (600 mg một lần hàng tháng). Điều trị trong 12 tháng. Liều cho trẻ em 10 - 14 tuổi clofazimin (50 mg/ngày uống cách nhật, cộng thêm 150 mg/lần/tháng), dapson (50 mg/lần hàng ngày) và rifampicin (450 mg/lần/tháng) dùng trong 12 tháng. Liều cho trẻ em < 10 tuổi nên điều chỉnh phù hợp: Rifampicin 300 mg/lần/tháng, clofazimin 50 mg/lần mỗi tuần 2 lần cộng thêm 100 mg/lần/tháng và dapson 25 mg/lần hàng ngày; điều trị 12 tháng.

Quá trình điều trị cần được giám sát việc dùng thuốc, WHO khuyến cáo nếu bệnh nhân phong thể nhiều vi khuẩn có chỉ số vi khuẩn cao khi điều trị thấy tình trạng đáp ứng không tốt (có bằng chứng các triệu chứng xấu hơn) thì sau khi hoàn thành phác đồ điều trị 12 tháng nên trên điều trị tiếp 12 tháng nữa.

Nếu bệnh nhân phong thể nhiều vi khuẩn không chấp nhận hoặc không dung nạp clofazimin, khuyến cáo người lớn dùng rifampin (600 mg một lần hàng tháng), ofloxacin (400 mg một lần hàng tháng) và minocyclin (100 mg một lần hàng tháng) điều trị trong 24 tháng.

Điều trị phong ít vi khuẩn: Thông thường khuyến cáo sử dụng phác đồ 2 thuốc gồm rifampicin và dapson. Nếu bệnh nhân không dùng được dapson thì thay thế bằng clofazimin (dùng liều khuyến cáo như trong điều trị phong thể nhiều vi khuẩn) trong 6 tháng.

Điều trị phản ứng hồng ban nút do phong: Khi phải điều trị cho bệnh nhân hồng ban nút do phong bằng corticoid kéo dài, dùng clofazimin 100 - 300 mg/ngày, chia thành 2 - 3 lần, thời gian dùng thuốc tới 3 tháng hoặc nếu dùng lâu hơn có thể bỏ hoặc giảm liều corticoid. Những bệnh nhân nặng hoặc hồng ban nút phụ thuộc corticoid cần kiểm soát phù hợp (giảm mức độ nặng và tần suất đợt cấp, giảm sử dụng corticoid cần điều trị clofazimin kéo dài (khoảng 7 tháng) và nếu cần kéo dài thời gian dùng thuốc thêm 9 - 24 tháng để đề phòng tái phát.

Liều dùng clofazimin nên được giảm dần cho tới liều thấp nhất có

hiệu quả (thí dụ tới 100 mg/ngày), giảm càng sớm càng tốt sau khi đã kiểm soát được giai đoạn kịch phát.

Điều trị bệnh do nhiễm MAC: Liều dùng ở người lớn nhiễm MAC là 100 mg/lần dùng 1 - 3 lần/ngày phối hợp với các thuốc chống lao khác. Liều cho trẻ em 1 - 2 mg/kg/ngày.

Điều trị lao đa kháng thuốc, lao siêu kháng thuốc: Clofazimin được xếp vào nhóm B (thuốc lựa chọn thay thế khi không sử dụng được thuốc nhóm A) trong danh mục thuốc điều trị bệnh lao đa kháng thuốc do WHO ban hành 2018. Liều ở người lớn là 100 mg/ngày dùng hàng ngày, thời gian 9 - 20 tháng tùy theo phác đồ.

Tương tác thuốc

Dapson: Dùng đồng thời clofazimin không ảnh hưởng đến dược động học của dapson, nhưng có bằng chứng là dapson có thể làm giảm hoặc mất một vài tác dụng chống viêm của clofazimin, nên cần phải tăng liều khi dùng cùng với dapson so với khi dùng clofazimin đơn độc. Tuy nhiên, cho tới nay vẫn chưa có bằng chứng clofazimin và dapson cản trở lẫn nhau về tác dụng chống *Mycobacterium*.

Rifampicin: Clofazimin có thể làm giảm tốc độ hấp thu rifampicin, làm rifampicin chậm đạt tới nồng độ đỉnh trong huyết tương, nhưng không ảnh hưởng đến nồng độ và nửa đời của rifampicin trong huyết tương hoặc thải trừ rifampicin qua nước tiểu. Việc điều trị phối hợp clofazimin, dapson và rifampicin vẫn được khuyến dùng.

Isoniazid: Có thể làm tăng nồng độ clofazimin trong nước tiểu, huyết tương và giảm nồng độ thuốc trên da.

Bedaquilin: Có thể tăng nguy cơ gây kéo dài khoảng QT.

Quá liều và xử trí

Ngộ độc cấp: Gây nôn hoặc rửa dạ dày. Điều trị triệu chứng và hỗ trợ.

Cập nhật lần cuối: 2018.

CLOMIFEN

Tên chung quốc tế: Clomifene (Clomiphene).

Mã ATC: G03GB02.

Loại thuốc: Thuốc kháng estrogen/thuốc gây phóng noãn.

Dạng thuốc và hàm lượng

Viên nén: 50 mg clomifen citrat.

Dược lực học

Clomifen là một chất không steroid gồm hỗn hợp 2 đồng phân. Thuốc có cả tác dụng estrogen lẫn tác dụng kháng estrogen (kháng estrogen do đồng phân E-isome). Thuốc có tác dụng kích thích rụng trứng, được cho là do tác dụng kháng estrogen. Nó kích thích bài tiết hormon gonadotropin tuyến yên, có thể do phong bế hồi tác âm của estrogen tại thụ thể ở vùng dưới đồi và tuyến yên.

Thuốc được dùng rộng rãi nhất để chữa vô sinh không phóng noãn. Sự điều trị cũng sẽ không thành công ở phụ nữ mà không còn có khả năng rụng trứng và chống bị vô sinh. Nó cũng không có tác dụng trong trường hợp suy tuyến yên và suy buồng trứng nguyên phát.

Dược động học

Thuốc dùng đường uống.

Khởi đầu tác dụng: Sự rụng trứng xảy ra sau 5 - 10 ngày của 1 đợt điều trị.

Thời gian tác dụng: Tác dụng của thuốc được tích tụ. Sự rụng trứng có thể xảy ra ở vòng kinh tiếp ngay sau đợt uống thuốc cuối cùng. Nửa đời thải trừ: 5 - 7 ngày.

Thời gian đỉnh huyết tương: Khoảng 6 giờ.

Khi uống, clomifen hấp thu ở đường tiêu hóa, chuyển hóa ở gan và đào thải chủ yếu theo phân, lượng nhỏ qua nước tiểu. Khoảng 51%