

nôn, buồn nôn bằng atropin hoặc một thuốc chống nôn (ví dụ như một thuốc nhóm phenothiazin). Giảm thiểu nguy cơ huyết khối bằng heparin và dextran 40. Ergotamin có thể bị loại bằng cách thẩm tách và lợi tiểu cưỡng bức.

Dấu hiệu quá liều mạn tính: Quá liều mạn tính các chế phẩm chứa ergotamin thường có biểu hiện thiếu máu cục bộ ngoại vi, có thể đe dọa đến sự sống còn các chi, đặc biệt là bàn chân và cẳng chân, trở nên tê, lạnh, cảm giác kiến bò, xanh xám hoặc xanh tím, đau cơ, có thể không có mạch ở chi. Thậm chí, có thể có hoại tử ở ngón chân hoặc đôi khi ở ngón tay. Đau thắt ngực, nhịp tim nhanh, nhịp tim chậm, tăng huyết áp hoặc tụt huyết áp cũng được ghi nhận. Nhồi máu cơ tim cũng có thể xảy ra nhưng hiếm gặp. Xơ hóa màng phổi và màng bụng cũng có thể xảy ra. Đau đầu mạn tính, khó chữa (đau đầu hồi ứng) có thể xảy ra và là biểu hiện chính của các triệu chứng cai thuốc trên các bệnh nhân lệ thuộc ergotamin. Các ADR khác bao gồm lú lẫn và co giật. Trên một số trường hợp hiếm gặp, có thể có các triệu chứng do co thắt các mạch máu trên não, mắt, ruột non và thận.

Điều trị quá liều mạn tính: Ngừng thuốc, truyền tĩnh mạch các thuốc giãn mạch như nitroprussid, nitroglycerin để thiết lập lại lưu lượng tuần hoàn. Captopril cũng có thể sử dụng để hồi phục lại những ảnh hưởng do quá liều mạn tính ergotamin.

Cập nhật lần cuối: 2020.

ERLOTINIB

Tên chung quốc tế: Erlotinib.

Mã ATC: L01XE03.

Loại thuốc: Thuốc ức chế kinase, chống ung thư.

Dạng thuốc và hàm lượng

Viên nén: 25 mg, 100 mg, 150 mg.

Dược lực học

Thụ thể loại 1 của yếu tố tăng trưởng biểu mô (EGFR - hoặc còn được biết đến với tên HER1) là những thụ thể xuyên màng, có trên bề mặt của tế bào thượng và tế bào ung thư. Ở một vài loại tế bào ung thư, con đường dẫn truyền tín hiệu thông qua thụ thể này đóng vai trò quan trọng cho sự tồn tại và nhân lên của tế bào bất kể thụ thể này có đột biến hay không. Erlotinib là chất ức chế có đảo ngược hoạt động tyrosine kinase của phần nội bào của thụ thể này, do ngăn cản quá trình tự phosphoryl hóa của phần hoạt động tyrosin, do đó ngăn cản con đường truyền tín hiệu qua thụ thể này. Trên mô hình thực nghiệm, ức chế phosphotyrosine dẫn đến tế bào không thể nhân lên và chết. Nếu các thụ thể EGFR có đột biến, nó dẫn đến việc hoạt hóa một cách liên tục các quá trình ngăn cản tế bào chết theo chương trình và tăng sinh tế bào. Ở khối u có đột biến EGFR dương tính, bao gồm mất đoạn exon 19 và đột biến exon 21 (L585R), erlotinib có tác dụng liên kết mạnh hơn với thụ thể EGFR ở vị trí hoạt động của tyrosine kinase. Trên mô hình thực nghiệm trên chuột có đột biến EGFR, đã quan sát được các khối u bị đẩy lùi.

Dược động học

Hấp thu: Erlotinib được hấp thu theo đường tiêu hóa; sinh khả dụng vào khoảng 60% khi uống lúc đói và có thể tăng lên tới 100% nếu uống lúc no. Nồng độ đỉnh huyết tương đạt được khoảng 4 giờ sau khi uống.

Phân bố: 93% thuốc gắn vào protein huyết tương (chủ yếu là albumin và α_1 -glycoprotein acid). Thể tích phân bố biểu kiến trung bình của thuốc là 232 lít.

Chuyển hóa: Erlotinib được chuyển hóa chủ yếu bởi coenzym

CYP3A4 của cytochrom P450, một phần nhỏ hơn bởi CYP1A2 ở gan. Thuốc cũng có khả năng chuyển hóa ngoài gan bởi CYP3A4 ở ruột, CYP1A1 ở phổi và 1B1 ở mô khối u.

Thời kỳ: Nửa đời thải trừ của thuốc vào khoảng 36 giờ. Độ thanh thải ở người hút thuốc lá cao hơn ở người không hút khoảng 24%. Hơn 80% liều được đào thải qua phân dưới dạng các chất chuyển hóa, khoảng 8% được đào thải qua nước tiểu.

Chỉ định

Điều trị bước 1 ung thư phổi không tế bào nhỏ giai đoạn tiến triển tại chỗ hoặc di căn có đột biến EGFR hoạt hóa.

Điều trị ung thư phổi không tế bào nhỏ giai đoạn tiến triển tại chỗ hoặc di căn đã thất bại điều trị với ít nhất 1 phác đồ hóa trị trước đó và có đột biến EGFR hoạt hóa.

Điều trị duy trì ung thư phổi không tế bào nhỏ cho bệnh nhân tiến triển tại chỗ hoặc di căn có đột biến EGFR hoạt hóa, đang ở trạng thái ổn định sau khi điều trị hóa chất bước 1.

Phối hợp với gemcitabin trong điều trị bước 1 cho bệnh ung thư tụy tiến triển tại chỗ, không phẫu thuật được hoặc đã có di căn.

Chống chỉ định

Đị ứng với erlotinib.

Thận trọng

Đã có những báo cáo về biến cố tim mạch nghiêm trọng như nhồi máu cơ tim thậm chí tử vong liên quan đến thuốc, đặc biệt trên bệnh nhân ung thư tụy.

Phản ứng rộp da, tróc da bao gồm cả hội chứng Stevens-Johnson đã được báo cáo. Cần ngừng thuốc ngay khi gặp các phản ứng nghiêm trọng này.

Thủng đường tiêu hóa thậm chí tử vong có thể xảy ra. Nguy cơ tăng lên ở những bệnh nhân có mắc kèm các bệnh như loét dạ dày, bệnh về túi thừa và bệnh nhân dùng kèm các thuốc như chống tạo mạch, corticoid, NSAID, hóa trị liệu bằng phác đồ chứa taxan. Ngừng thuốc vĩnh viễn nếu có biến cố thủng đường tiêu hóa xảy ra.

Độc tính trên gan bao gồm suy gan, hội chứng gan thận thậm chí tử vong, đã được ghi nhận, ngay cả ở bệnh nhân có chức năng gan bình thường. Nguy cơ gặp biến cố này tăng ở bệnh nhân đã bị suy gan khi bắt đầu dùng thuốc. Cần giám sát chức năng gan và dùng thuốc nếu cần.

Các ca bệnh phổi mô kẽ (ILD) nghiêm trọng bao gồm cả ca tử vong đã được ghi nhận. Khi xuất hiện các dấu hiệu cấp tính của các triệu chứng ở phổi mới hoặc tiến triển, chưa giải thích được (như ho, khó thở, sốt) cần tạm dừng erlotinib để chờ chẩn đoán. Ngừng thuốc nếu chẩn đoán xác định bệnh phổi mô kẽ.

Suy giảm chức năng thận, hội chứng gan thận và suy thận cấp thậm chí tử vong đã được báo cáo. Nguy cơ này tăng lên ở bệnh nhân suy giảm chức năng gan và mất nước nghiêm trọng.

Thời kỳ mang thai

Dữ liệu trên động vật và cơ chế của thuốc cho thấy thuốc có khả năng gây ra các tác dụng bất lợi với thai nhi khi dùng cho phụ nữ mang thai. Dùng cho người mang thai phải cân nhắc kỹ và cảnh báo về nguy cơ có thể bị hỏng thai.

Phụ nữ trong độ tuổi sinh sản phải được hướng dẫn sử dụng các biện pháp tránh thai một cách đầy đủ trong suốt quá trình điều trị và cho đến khi kết thúc điều trị ít nhất 2 tuần.

Thời kỳ cho con bú

Không rõ thuốc có được bài tiết qua sữa không. Phụ nữ dùng erlotinib nên ngừng cho con bú cho tới khi kết thúc điều trị ít nhất 2 tuần.

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

Tim mạch: đau ngực, phù, huyết khối.

Thần kinh: mệt mỏi, đau đầu, lo âu, chóng mặt, mất ngủ, nhiễm độc thần kinh, dị cảm.

Tiêu hóa: tiêu chảy, chán ăn, buồn nôn, nôn, viêm miệng, đau bụng, táo bón, xét nghiệm chức năng gan bất thường.

Da và mô mềm: nổi mẩn, ngứa, mụn trứng cá, viêm quanh móng, rụng tóc.

Cơ xương: yếu cơ, đau lưng, đau khớp, đau cơ xương.

Tiết niệu: nhiễm khuẩn tiết niệu.

Huyết học: thiếu máu.

Mắt: viêm kết mạc, viêm giác mạc khô.

Hô hấp: ho, khó thở.

Toàn thân: sốt.

Thường gặp

Tiêu hóa: chảy máu dạ dày, ruột.

Da: khô da, viêm nang lông, viêm da mụn trứng cá, nứt da, nhiễm trùng quanh móng, rụng tóc.

Nội tiết và chuyển hóa: giảm cân.

Thận: suy giảm chức năng thận.

Hô hấp: chảy máu cam.

Ít gặp

Mắt: thay đổi lông mi.

Hô hấp: bệnh phổi mô kẽ.

Tiêu hóa: thủng dạ dày ruột.

Da: chứng rậm lông, thay đổi lông mày, long móng, phản ứng da nhẹ như tăng sắc tố da.

Thận: protein niệu, viêm thận.

Huyết học: giảm bạch cầu lympho, giảm bạch cầu, giảm tiểu cầu.

Cơ xương: co cơ, đau cơ xương vùng ngực.

Hiếm gặp

Tiêu hóa: suy gan.

Da: hội chứng vết ban đỏ mắt cảm giác ở lòng bàn tay - bàn chân.

Rất hiếm gặp

Mắt: đục giác mạc, loét giác mạc, viêm màng bồ đào.

Da và niêm mạc: hội chứng Stevens-Johnson.

Hướng dẫn cách xử trí ADR

Nếu xuất hiện biểu hiện cấp hoặc các dấu hiệu ở phổi tăng (khó thở, ho, sốt) thì phải tạm ngừng dùng erlotinib cho đến khi có chẩn đoán xác định. Nếu đó là bệnh phổi mô kẽ thì phải ngừng hẳn erlotinib và điều trị thích hợp.

Độc tính trên gan: Nếu độc tính trên gan không cải thiện đáng kể hoặc hồi phục trong vòng 3 tuần thì phải ngừng thuốc. Ở những bệnh nhân có tiền sử suy gan hoặc tắc mật nếu xuất hiện bilirubin cao hơn 2 lần hoặc enzym gan tăng hơn 3 lần so với khi bắt đầu điều trị thì tạm dừng erlotinib cân nhắc ngừng hẳn thuốc. Ở bệnh nhân không có tiền sử suy gan, xuất hiện bilirubin cao hơn 3 lần hoặc enzym gan tăng hơn 5 lần so với mức giới hạn bình thường trên, tạm dừng erlotinib và cân nhắc ngừng hẳn thuốc. Nếu vẫn tiếp tục dùng, đợi đến khi các giá trị xét nghiệm bilirubin và enzym gan trở về mức nền bằng khi bắt đầu dùng thuốc, dùng lại với liều erlotinib giảm đi 50 mg.

Độc tính trên thận nặng (độ 3 hoặc 4 theo tiêu chuẩn thông dụng để đánh giá các biến cố bất lợi - CTCAE) tạm dừng erlotinib và cân nhắc ngừng hẳn thuốc. Nếu vẫn tiếp tục dùng, phải đợi đến khi độc tính trên thận độ 1 hoặc nhỏ hơn hoặc bằng khi bắt đầu dùng thuốc, liều bắt đầu lại của erlotinib nên giảm đi 50 mg.

Nếu bị thủng đường tiêu hóa: Phải ngừng hẳn dùng thuốc.

Nếu bị tiêu chảy nặng dai dẳng và không đáp ứng với điều trị (như loperamid), phải tạm ngừng dùng thuốc đến khi độc tính giảm

xuống \leq độ 1. Khi đó có thể dùng lại thuốc với liều thấp hơn 50 mg. Nếu có phản ứng nặng phỏng rộp tróc da phải ngừng dùng thuốc. Nếu bị nổi mẩn nghiêm trọng và không đáp ứng với các điều trị triệu chứng, tạm dừng thuốc đến khi độc tính giảm xuống \leq độ 1, có thể dùng lại thuốc với liều thấp hơn 50 mg.

Nếu gặp các độc tính trên mắt như thủng hoặc loét giác mạc nặng phải ngừng thuốc. Nếu bị độc tính cấp lên mắt hoặc các tình trạng trên mắt nặng lên như đau nhức mắt, tạm ngừng và cân nhắc ngừng hẳn erlotinib. Viêm giác mạc độ 3, 4 hoặc độ 2 kéo dài trên 2 tuần, tạm dừng thuốc. Khi các độc tính trên giảm xuống \leq độ 1, nếu dùng lại thuốc, liều giảm đi 50 mg.

Liều lượng và cách dùng

Ung thư phổi không phải tế bào nhỏ: 150 mg/ngày, uống 1 giờ trước hoặc 2 giờ sau bữa ăn. Duy trì điều trị cho đến khi thấy bệnh tiến triển hoặc bị độc tính đến mức không thể chấp nhận được.

Ung thư tụy: 100 mg/ngày, uống 1 giờ trước hoặc 2 giờ sau bữa ăn, uống cùng gemcitabin. Ở bệnh nhân không nổi mẩn ở da trong vòng 4 đến 8 tuần điều trị, cần đánh giá lại việc dùng thuốc. Ở bệnh nhân nếu cần phải giảm liều, mỗi lần giảm 50 mg. Trị liệu được duy trì cho đến khi thấy bệnh tiến triển hoặc bị độc tính đến mức không thể chấp nhận được.

Người suy gan (bilirubin toàn phần lớn hơn mức giới hạn bình thường trên, hoặc Child-pugh A, B hoặc C): cần được giám sát chặt chẽ khi dùng thuốc, đặc biệt là bệnh nhân có bilirubin lớn hơn 3 lần giới hạn trên. Giảm liều hoặc ngừng thuốc nếu gặp tác dụng không mong muốn nghiêm trọng. Không khuyến cáo dùng thuốc cho bệnh nhân suy gan nặng.

Người suy thận: Thuốc chưa được nghiên cứu trên bệnh nhân suy thận (nồng độ creatinine huyết thanh lớn hơn 1,5 lần giới hạn bình thường trên). Dựa vào dữ liệu về dược động học, không cần chỉnh liều thuốc cho bệnh nhân suy thận mức độ nhẹ và trung bình. Không khuyến cáo dùng thuốc cho bệnh nhân suy thận nặng.

Tương tác thuốc

Các thuốc ức chế izoenzym CYP3A4 mạnh (boceprevir, ketoconazol, atazanavir, clarithromycin, indinavir, itraconazol, nefazodon, nelfinavir, ritonavir, saquinavir, telithromycin, troleandomycin, voriconazol, bưởi chùm/nước bưởi chùm) và thuốc ức chế đồng thời CYP3A4 và CYP1A2 (như ciprofloxacin) làm tăng nồng độ erlotinib. Tránh dùng kết hợp với các thuốc này. Nếu buộc phải dùng thì phải thận trọng và giảm liều 50 mg.

Các thuốc kích thích CYP3A4 (rifampicin, carbamazepin, phenobarbital, phenytoin, rifabutin, rifapentin, cô St. John) làm tăng tốc độ chuyển hóa erlotinib. Tránh dùng erlotinib với các thuốc trên. Nếu buộc phải dùng đồng thời, tăng liều erlotinib thêm 50 mg mỗi 2 tuần cho đến liều tối đa là 450 mg.

Thuốc ức chế CYP1A2 mức độ trung bình (như teriflunomid, rifampin, phenytoin) và hút thuốc lá (cũng làm ức chế CYP1A2) làm tăng nồng độ erlotinib. Tránh hút thuốc hoặc dùng đồng thời các thuốc trên với erlotinib. Bệnh nhân hút thuốc hoặc phải dùng đồng thời với các thuốc trên cần được tăng liều thêm 50 mg mỗi 2 tuần đến liều tối đa 300 mg. Giảm liều về mức bình thường ngay khi bệnh nhân ngừng hút thuốc.

Các thuốc làm tăng độ pH của đường tiêu hóa trên làm giảm độ hòa tan của erlotinib và làm giảm khả dụng sinh học của thuốc. Dùng đồng thời với omeprazol làm giảm 46% AUC và làm giảm 61% C_{max} của erlotinib. Dùng đồng thời với 300 mg ranitidin làm giảm 33% AUC và giảm 54% C_{max} của erlotinib. Tăng liều erlotinib không khắc phục được tương tác này. Tránh dùng đồng thời erlotinib với thuốc ức chế bơm proton do các thuốc này tác động kéo dài trên độ pH đường tiêu hóa trên. Tuy nhiên khi dùng

erlotinib 2 giờ trước và 10 giờ sau khi dùng ranitidin 150 mg/2 lần/ngày thì AUC và C_{max} của erlotinib giảm lần lượt 15 và 17%. Nếu bắt buộc phải dùng đồng thời, erlotinib nên được uống sau 10 giờ và trước ít nhất 2 giờ so với thời điểm dùng thuốc kháng thụ thể H_2 . Dùng cùng với thuốc kháng acid cũng chưa được nghiên cứu, nếu buộc phải dùng cùng thì phải uống cách erlotinib nhiều giờ. Tương tác với các thuốc chống đông nguồn gốc coumarin như warfarin làm tăng biến cố chảy máu và tăng chỉ số INR. Cần theo dõi chặt chẽ thời gian prothrombin hoặc INR ở người dùng đồng thời erlotinib và thuốc chống đông coumarin.

Quá liều và xử trí

Triệu chứng: Có thể dung nạp được liều đơn nhỏ hơn hoặc bằng 1 000 mg erlotinib ở người khỏe mạnh hoặc 1 600 mg ở bệnh nhân ung thư. Liều lặp lại 200 mg 2 lần/ngày ở người khỏe mạnh kém dung nạp sau vài ngày. Có thể xuất hiện các tác dụng không mong muốn nghiêm trọng như tiêu chảy, nổi mẩn, tăng hoạt tính của các enzym aminotransferase của gan khi dùng liều cao hơn so với liều khuyến cáo.

Xử trí: Trong trường hợp quá liều hoặc nghi ngờ quá liều, cần ngừng thuốc và điều trị triệu chứng.

Cập nhật lần cuối: 2020.

ERTAPENEM NATRI

Tên chung quốc tế: Ertapenem sodium.

Mã ATC: J01DH03.

Loại thuốc: Kháng sinh nhóm carbapenem, họ beta-lactam.

Dạng thuốc và hàm lượng

Lọ bột pha tiêm chứa 1,046 g ertapenem natri tương đương với 1 g ertapenem base.

Được lực học

Cơ chế tác dụng: Ertapenem là một kháng sinh tổng hợp nhóm carbapenem, có cấu trúc và tác dụng dược lý tương tự các thuốc trong nhóm là imipenem và meropenem. Giống meropenem nhưng khác với imipenem, ertapenem bền vững với tác dụng thủy phân của dehydropeptidase 1 (DHP-1) có ở diềm bản chải của tế bào biểu mô ống lượn gần, vì vậy không cần dùng cùng với chất ức chế DHP-1 như cilastatin.

Thuốc có tác dụng diệt khuẩn thông qua ức chế sự tổng hợp vách tế bào của các vi khuẩn Gram âm, Gram dương hiếu khí và kỵ khí do gắn với protein liên kết penicilin (PBP) và làm bất hoạt các protein này. Ertapenem không bị thủy phân bởi nhiều beta-lactamase khác nhau như penicilinase, cephalosporinase và beta-lactamase phổ rộng, nhưng bị thủy phân bởi metallo-beta-lactamase. Tác dụng hậu kháng sinh của thuốc được ghi nhận đối với một số vi khuẩn Gram dương và Gram âm (ví dụ *H.influenza*).

Phổ tác dụng: Ertapenem có tác dụng trên các vi khuẩn Gram dương, Gram âm hiếu khí và các vi khuẩn kỵ khí.

Ertapenem có tác dụng *in vitro* và trên lâm sàng đối với các vi khuẩn: *Staphylococcus aureus* (chỉ các chủng nhạy cảm với methicilin) *Streptococcus pneumoniae* (chỉ các chủng nhạy cảm penicilin), *S. pyogenes*, *S. agalactiae*, *Escherichia coli*, *Haemophilus influenzae* (chỉ các chủng không tiết beta-lactamase), *Klebsiella pneumoniae*, *Moxarella catarrhalis*, *Bacteroides fragilis*, *B. distasonis*, *B. ovatus*, *B. thetaiotaomicron*, *B. uniformis*, *Clostridium clostridioforme*, *Eubacterium lentum*, *Peptostreptococcus spp.*, *Porphyromonas asaccharolytica* và *Prevotella bivia*.

Ngoài ra, ertapenem được chứng minh có tác dụng *in vitro* đối với các vi khuẩn: *S. pneumoniae* (các chủng nhạy trung gian với

penicilin), *Citrobacter freundii*, *C. koseri*, *Enterobacter aerogenes*, *E. cloacae*, *H. influenzae* (các chủng sản xuất beta-lactamase), *H. parainfluenzae*, *Klebsiella oxytoca* (ngoại trừ các chủng sản xuất beta-lactamase phổ rộng), *Morganella morganii*, *Proteus mirabilis*, *P. vulgaris*, *Serratia marcescens*, *C. perfringens* và *Fusobacterium spp.*. Tuy nhiên, hiệu quả và an toàn của ertapenem trong điều trị nhiễm khuẩn do các vi khuẩn này gây ra hiện chưa được chứng minh đầy đủ.

So với imipenem, tác dụng *in vitro* của ertapenem có phần mạnh hơn trên họ vi khuẩn Enterobacteriaceae, nhưng yếu hơn trên cầu khuẩn Gram dương, *Pseudomonas aeruginosa* và *Acinetobacter*. Cả hai thuốc đều có hoạt tính yếu đối với cầu khuẩn ruột (enterococcus), đặc biệt là các chủng kháng vancomycin.

Kháng thuốc: Tụ cầu kháng methicilin và cầu khuẩn đường ruột phát sinh tính kháng ertapenem do gây bất hoạt PBP. *P.aeruginosa* và các vi khuẩn không lên men thường kháng ertapenem do làm giảm tính thấm thuốc và sản xuất bơm tống thuốc. Kháng thuốc không phổ biến ở họ vi khuẩn Enterobacteriaceae vì ertapenem thường bền vững trước các beta-lactamase phổ rộng (ESBL). Tuy nhiên, kháng thuốc có thể xảy ra khi ESBL hay các beta-lactamase hoạt lực mạnh (ví dụ AmpC) xuất hiện cùng lúc với sự giảm tính thấm qua màng do giảm số lượng kênh porin màng ngoài, hoặc tăng sản xuất bơm tống thuốc. Kháng thuốc cũng có thể phát sinh do thu nhận các beta-lactamase có hoạt tính thủy phân carbapenem đáng kể (ví dụ, metallo-beta-lactamase IMP và VIM hoặc KPC), tuy nhiên khả năng này hiếm khi xảy ra.

Được động học

Hấp thu: Sau khi truyền tĩnh mạch 1 g ertapenem trong 30 phút cho người lớn, nồng độ thuốc trung bình trong huyết tương thu được là 155 microgam/ml ngay khi kết thúc truyền, 9 microgam/ml sau 12 giờ và 1 microgam/ml sau 24 giờ. Sau khi tiêm bắp liều như trên, nồng độ thuốc trong huyết tương khoảng 67 microgam/ml, đạt được sau 2 giờ. Sinh khả dụng của thuốc khi tiêm bắp là 90%. Diện tích dưới đường cong nồng độ thuốc trong huyết tương (AUC) theo thời gian của ertapenem ở người lớn tăng tỉ lệ với liều trong khoảng liều từ 0,5 - 2 g. Không thấy có sự tích lũy thuốc ở người lớn khi dùng nhiều liều tĩnh mạch từ 0,5 - 2 g mỗi ngày.

Sau khi truyền tĩnh mạch 15 mg/kg (tối đa 1 g) ertapenem trong 30 phút cho trẻ 3 - 23 tháng, nồng độ thuốc trung bình trong huyết tương thu được là 103,8 microgam/ml ngay khi kết thúc truyền, 13,5 microgam/ml sau 6 giờ và 2,5 microgam/ml sau 12 giờ.

Sau khi truyền tĩnh mạch 15 mg/kg (tối đa 1 g) ertapenem trong 30 phút cho trẻ 2 - 12 tuổi, nồng độ thuốc trung bình trong huyết tương thu được là 113,2 microgam/ml ngay khi kết thúc truyền, 12,8 microgam/ml sau 6 giờ và 3,0 microgam/ml sau 12 giờ.

Sau khi truyền tĩnh mạch 20 mg/kg (tối đa 1 g) ertapenem trong 30 phút cho trẻ 13 - 17 tuổi, nồng độ thuốc trung bình trong huyết tương thu được là 170,4 microgam/ml ngay khi kết thúc truyền, 7,0 microgam/ml sau 12 giờ và 1,1 microgam/ml sau 24 giờ.

Phân bố: Thuốc liên kết với protein huyết tương trên 90%. Ở người lớn, tỉ lệ liên kết protein của ertapenem giảm đi khi nồng độ thuốc tăng lên. Các nghiên cứu *in vitro* cho thấy ertapenem không ảnh hưởng nhiều đến tỉ lệ gắn protein của các thuốc gắn mạnh như warfarin, ethinyl estradiol và norethindron. Trên *in vivo*, probenecid có thể làm giảm tỉ lệ liên kết protein của ertapenem, tuy nhiên ảnh hưởng này không đáng kể. Thể tích phân bố của ertapenem ở người lớn là 0,12 lít/kg, ở trẻ 3 tháng - 12 tuổi là 0,21 lít/kg và ở trẻ 13 - 17 tuổi là 0,17 lít/kg. Ertapenem được bài tiết vào sữa.

Chuyển hóa: Một phần ertapenem bị thủy phân vòng beta-lactam bởi dehydropeptidase I ở thận thành chất chuyển hóa vòng mở