

IBUPROFEN

Tên chung quốc tế: Ibuprofen.

Mã ATC: C01EB16, G02CC01, M01AE01, M02AA13.

Loại thuốc: Thuốc chống viêm không steroid.

Dạng thuốc và hàm lượng

Viên nén: 100 mg, 150 mg, 200 mg, 300 mg, 400 mg.

Viên nang: 200 mg.

Kem dùng ngoài: 5% (dùng tại chỗ).

Sirô: 20 mg/ml.

Viên nén phối hợp: 200 mg ibuprofen và 350 mg paracetamol, 200 mg ibuprofen với 7,5 mg hydrocodon, 200 mg ibuprofen với 30 mg pseudoephedrin hydroclorid.

Viên bao phim phối hợp: 200 mg ibuprofen với 30 mg pseudoephedrin hydroclorid.

Hỗn dịch: 100 mg ibuprofen với 15 mg/5 ml pseudoephedrin hydroclorid.

Thuốc tiêm tĩnh mạch: 100 mg/ml.

Dược lực học

Ibuprofen là thuốc chống viêm không steroid, dẫn xuất từ acid propionic. Tương tự như các thuốc chống viêm không steroid khác, ibuprofen có tác dụng giảm đau, hạ sốt và chống viêm. Cơ chế tác dụng của thuốc là ức chế enzym prostaglandin synthetase và do đó ngăn tạo ra prostaglandin, thromboxan và các sản phẩm khác của enzym cyclooxygenase. Ibuprofen cũng ức chế tổng hợp prostacyclin ở thận và có thể gây nguy cơ ứ nước do làm giảm dòng máu tới thận. Cần phải lưu ý đến điều này khi chỉ định cho người bệnh có suy thận, suy tim, suy gan và các bệnh có rối loạn về thể tích huyết tương.

Tác dụng chống viêm của ibuprofen xuất hiện sau hai ngày điều trị. Ibuprofen có tác dụng hạ sốt mạnh hơn aspirin, nhưng kém indomethacin. Thuốc có tác dụng chống viêm tốt và có tác dụng giảm đau tốt trong điều trị viêm khớp tự phát ở trẻ em.

Dược động học

Ibuprofen hấp thu tốt ở ống tiêu hóa. Nồng độ tối đa của thuốc trong huyết tương đạt được sau khi uống từ 1 - 2 giờ. Thuốc gắn rất nhiều với protein huyết tương. Nửa đời thải trừ của thuốc khoảng 2 giờ. Ibuprofen đào thải rất nhanh qua nước tiểu (1% dưới dạng không đổi, 14% dưới dạng liên hợp).

Chỉ định

Giảm đau và chống viêm từ nhẹ đến vừa: Trong một số bệnh như đau đầu, đau răng. Dùng ibuprofen có thể giảm bớt liều thuốc chứa thuốc phiện trong điều trị đau sau đại phẫu thuật hay đau do ung thư. Viêm khớp dạng thấp, viêm khớp tự phát ở trẻ em.

Hạ sốt ở trẻ em.

Chứng cơn ống động mạch ở trẻ sơ sinh thiếu tháng nặng 500 đến 1 500 gam, dưới 32 tuần tuổi thai khi các liệu pháp khác không có hiệu quả (như hạn chế dịch, lợi tiểu, hỗ trợ hô hấp,...).

Đau bụng kinh.

Chống chỉ định

Mẫn cảm với ibuprofen.

Loét dạ dày tá tràng tiến triển.

Quá mẫn với aspirin hoặc với các thuốc chống viêm không steroid khác (hen, viêm mũi, nổi mề đay sau khi dùng aspirin).

Người bệnh bị hen hay bị co thắt phế quản, rối loạn chảy máu, bệnh tim mạch, tiền sử loét dạ dày tá tràng, suy gan hoặc suy thận (mức lọc cầu thận dưới 30 ml/phút).

Người bệnh đang được điều trị bằng thuốc chống đông coumarin.

Người bệnh bị suy tim sung huyết (độ IV theo phân loại của NYHA), bị giảm khối lượng tuần hoàn do thuốc lợi niệu hoặc bị

suy thận (tăng nguy cơ rối loạn chức năng thận).

Người bệnh mắc một trong nhóm bệnh mô liên kết (có nguy cơ bị viêm màng não vô khuẩn; cần chú ý là tất cả người bệnh bị viêm màng não vô khuẩn đều đã có tiền sử mắc một bệnh tự miễn).

Ba tháng cuối của thai kỳ.

Trẻ sơ sinh thiếu tháng đang có chảy máu như chảy máu dạ dày, xuất huyết trong sọ và trẻ có giảm tiểu cầu và rối loạn đông máu. Trẻ sơ sinh có nhiễm khuẩn hoặc nghi ngờ nhiễm khuẩn chưa được điều trị. Trẻ sơ sinh thiếu tháng nghi ngờ viêm ruột hoại tử. Trẻ sơ sinh bị suy thận.

Không bôi vào vùng da hở hoặc bị tổn thương

Thận trọng

Cần thận trọng khi dùng ibuprofen đối với người cao tuổi.

Ibuprofen có thể làm các enzym transaminase tăng lên trong máu, nhưng biến đổi này thoáng qua và hồi phục được.

Rối loạn thị giác như nhìn mờ là dấu hiệu chủ quan và có liên quan đến ADR của thuốc nhưng sẽ hết khi ngừng dùng ibuprofen.

Ibuprofen ức chế kết tập tiểu cầu nên có thể làm cho thời gian chảy máu kéo dài.

Cần theo dõi chức năng gan thường xuyên khi sử dụng ibuprofen lâu dài. Nồng độ ALT huyết tương là chỉ số nhạy nhất để đánh giá nguy cơ làm giảm chức năng gan của thuốc chống viêm không steroid.

Cần thận trọng và theo dõi chặt chẽ bệnh nhân suy giảm chức năng thận khi sử dụng ibuprofen.

Ở người có acid phenylpyruvic niệu (như thiếu enzym phenylalanin hydroxylase) và những người phải hạn chế sử dụng phenylalanin nên thận trọng khi dùng biệt dược có chứa aspartam (chất chuyển hóa qua đường tiêu hóa tạo thành phenylalanin).

Cần theo dõi chặt chẽ nguy cơ chảy máu khi dùng ibuprofen ở trẻ sơ sinh thiếu tháng.

Thận trọng khi sử dụng ibuprofen ở trẻ sơ sinh thiếu tháng có nguy cơ nhiễm khuẩn hoặc nhiễm khuẩn chưa được kiểm soát đầy đủ.

Khi sử dụng ibuprofen có thể làm tăng huyết áp hoặc làm nặng hơn bệnh tăng huyết áp, làm tăng nguy cơ các biến cố tim mạch. Ibuprofen làm tăng nguy cơ biến cố tim mạch nghiêm trọng do huyết khối. Nguy cơ biến cố tim mạch của ibuprofen tăng ở bệnh nhân có bệnh tim mạch hoặc có yếu tố nguy cơ mắc bệnh tim mạch. Để giảm thiểu các biến cố tim mạch nên dùng liều thấp nhất có hiệu quả và trong thời gian ngắn nhất. Bệnh nhân cần được thông tin về các triệu chứng độc tính nghiêm trọng trên tim mạch (đau ngực, khó thở, yếu, nói khó) và hướng dẫn xử trí khi các triệu chứng này xảy ra.

Ibuprofen nên sử dụng thận trọng ở bệnh nhân có ứ dịch, suy tim vì đã có báo cáo về ADR ứ dịch và phù xảy ra khi sử dụng các thuốc này.

Cần thận trọng vì tác dụng hạ nhiệt và chống viêm của ibuprofen có thể che mờ các dấu hiệu và triệu chứng viêm của các bệnh khác.

Ibuprofen nên thận trọng khi sử dụng ở bệnh nhân tăng bilirubin toàn phần vì nguy cơ foribuprofen thay thế bilirubin trong liên kết với albumin.

Thời kỳ mang thai

Ibuprofen có thể ức chế co bóp tử cung và làm chậm quá trình chuyển dạ. Ibuprofen cũng có thể gây tăng áp lực phổi nặng và suy hô hấp nặng ở trẻ sơ sinh do đóng sớm ống động mạch trong tử cung. Ibuprofen ức chế chức năng tiểu cầu, làm tăng nguy cơ chảy máu. Do ức chế tổng hợp prostaglandin nên có thể gây ADR trên hệ tim mạch của thai.

Sau khi uống các thuốc chống viêm không steroid cũng có nguy cơ ít nước ối và vô niệu ở trẻ sơ sinh. Trong 3 tháng cuối thai kỳ, phải hết sức hạn chế sử dụng đối với bất cứ thuốc chống viêm nào. Các thuốc này chống chỉ định tuyệt đối trong vài ngày trước khi sinh.

Thời kỳ cho con bú

Ibuprofen vào sữa mẹ rất ít, không đáng kể. Ít khả năng xảy ra nguy cơ cho trẻ ở liều bình thường với mẹ. Các nhà sản xuất vẫn khuyến cáo không nên dùng ibuprofen trong thời gian cho con bú vì nguy cơ ức chế prostaglandin tiềm tàng ở trẻ sơ sinh.

Tác dụng không mong muốn (ADR)

5 - 15% người bệnh có ADR về tiêu hóa.

Thường gặp

Toàn thân: sốt, mỏi mệt.

Tiêu hóa: trướng bụng, buồn nôn, nôn.

TKTW: nhức đầu, hoa mắt chóng mặt, bồn chồn.

Da: mẩn ngứa, ngoại ban.

Ít gặp

Toàn thân: phản ứng dị ứng (đặc biệt co thắt phế quản ở người bệnh bị hen), viêm mũi, nổi mề đay.

Tiêu hóa: đau bụng, chảy máu dạ dày - ruột, làm loét dạ dày tiến triển.

TKTW: lơ mơ, mất ngủ, ù tai.

Mắt: rối loạn thị giác.

Tai: thính lực giảm.

Máu: thời gian máu chảy kéo dài.

Hiếm gặp

Toàn thân: phù, nổi ban, hội chứng Stevens-Johnson, rụng tóc, hạ natri. TKTW: trầm cảm, viêm màng não vô khuẩn và hôn mê, nhìn mờ, rối loạn nhìn màu, giảm thị lực do ngộ độc thuốc.

Máu: giảm bạch cầu, giảm tiểu cầu, giảm bạch cầu trung tính, tăng bạch cầu ưa eosin, giảm bạch cầu hạt, thiếu máu.

Tiêu hóa: rối loạn co bóp túi mật, các thử nghiệm thăm dò chức năng gan bất thường, nhiễm độc gan. Viêm ruột hoại tử, hội chứng Crohn, viêm tụy.

Tiết niệu - sinh dục: viêm bàng quang, đái ra máu, suy thận cấp, viêm thận kẽ, hội chứng thận hư.

Da: nhạy cảm với ánh sáng, viêm da tróc vảy.

Hướng dẫn cách xử trí ADR

Nếu người bệnh thấy nhìn mờ, giảm thị lực, hoặc rối loạn cảm nhận màu sắc thì phải ngừng dùng ibuprofen.

Nếu có rối loạn nhẹ về tiêu hóa thì nên uống thuốc lúc ăn hay uống với sữa.

Liều lượng và cách dùng

Người lớn: Liều uống thông thường để *giảm đau*: 1,2 - 1,8 g/ngày, chia làm nhiều liều nhỏ, tuy liều duy trì 0,6 - 1,2 g/ngày đã có hiệu quả. Nếu cần, liều có thể tăng lên, liều tối đa khuyến cáo là 2,4 g/ngày hoặc 3,2 g/ngày. Người bệnh bị viêm khớp dạng thấp thường phải dùng ibuprofen liều cao hơn so với người bị thoái hóa khớp. Liều khuyến cáo *hạ sốt* là 200 - 400 mg, cách nhau 4 - 6 giờ/lần, cho tới tối đa là 1,2 g/ngày.

Liều thông thường trong *đau bụng trong thời kỳ kinh nguyệt* là 200 mg mỗi 4 - 6 giờ, cần dùng ngay khi bị đau và tăng lên 400 mg mỗi 4 - 6 giờ nếu cần thiết nhưng không quá 1,2 g/ngày.

Trẻ em: Liều uống thông thường để *giảm đau hoặc sốt* là 20 - 30 mg/kg/ngày, chia làm nhiều liều nhỏ. Tối đa có thể cho 40 mg/kg/ngày để điều trị viêm khớp dạng thấp thiếu niên nếu cần.

Ibuprofen thường không khuyến cáo dùng cho trẻ cân nặng dưới 7 kg và một số nhà sản xuất gợi ý liều tối đa hàng ngày là 500 mg đối với trẻ cân nặng dưới 30 kg.

Một cách khác, liều gợi ý cho trẻ em là: Đối với sốt, 5 - 10 mg/kg (phụ thuộc vào mức độ sốt) và đối với đau, 10 mg/kg; liều có thể cho cách nhau 6 - 8 giờ/lần, liều tối đa hàng ngày 40 mg/kg.

Giảm đau và hạ sốt:

Trẻ 1 - 3 tháng: 5 mg/kg × 3 - 4 lần/ngày.

Trẻ 3 - 6 tháng: (cân nặng trên 5 kg) 50 mg × 3 lần/ngày. Tối đa 30 mg/kg/ngày, chia 3 - 4 lần/ngày.

Trẻ 6 - 12 tháng: 50 mg × 3 lần/ngày. Tối đa 30 mg/kg/ngày, chia

3 - 4 lần/ngày.

Trẻ 1 - 4 tuổi: 100 mg × 3 lần/ngày. Tối đa 30 mg/kg/ngày, chia 3 - 4 lần/ngày.

Trẻ 4 - 7 tuổi: 150 mg × 3 lần/ngày. Tối đa 30 mg/kg/ngày, chia 3 - 4 lần/ngày.

Trẻ 7 - 10 tuổi: 200 mg × 3 lần/ngày. Đến 30 mg/kg/ngày, chia 3 - 4 lần/ngày, tối đa 2,4 g/ngày.

Trẻ 10 - 12 tuổi: 300 mg × 3 lần/ngày. Đến 30 mg/kg/ngày, chia 3 - 4 lần/ngày, tối đa 2,4 g/ngày.

Trẻ 12 - 18 tuổi: Khởi đầu 300 - 400 mg × 3 - 4 lần/ngày; tăng lên tới 600 mg × 4 lần/ngày nếu cần. Liều duy trì là 200 - 400 mg × 3 lần/ngày.

Viêm khớp dạng thấp bao gồm viêm khớp tự phát ở trẻ em:

Trẻ 3 tháng - 18 tuổi: (cân nặng trên 5 kg) 10 mg/kg × 3 - 4 lần/ngày. Có thể tăng đến 60 mg/kg/ngày, chia 3 - 4 lần trong viêm khớp tự phát ở trẻ em. Tối đa 2,4 g/ngày.

Thông ống động mạch ở trẻ sơ sinh thiếu tháng:

Một đợt điều trị gồm ba liều ibuprofen, mỗi liều truyền trên 30 phút, cách nhau 24 giờ. Liều khởi đầu là 10 mg/kg, hai liều tiếp theo mỗi liều là 5 mg/kg. Nếu thiếu niệu hoặc bí tiểu (như lượng nước tiểu dưới 0,6 ml/kg/giờ) xảy ra khi dùng liều thứ hai hoặc thứ ba thì phải ngừng thuốc cho đến khi xét nghiệm cho thấy chức năng thận đã trở về bình thường. Nếu sau đợt điều trị này 48 giờ, ống động mạch vẫn mờ, dùng thêm một đợt điều trị nữa, nếu vẫn không đáp ứng cần cân nhắc phẫu thuật. Nếu dùng ibuprofen dạng base, không cần pha loãng thuốc (nếu cần pha loãng với dung dịch glucose 5% hoặc natri clorid 0,9%). Nếu dùng dạng muối ibuprofen lysin cần phải pha loãng với dung dịch glucose 5% hoặc natri clorid 0,9%.

Chưa xác định được độ an toàn của thuốc ở người suy thận. Để tránh thuốc tích lũy quá nhiều, nhà sản xuất khuyến nên giảm liều ibuprofen ở người có tổn thương chức năng thận.

Tương tác thuốc

Ibuprofen hiệp đồng tác dụng với warfarin gây chảy máu dạ dày. Phối hợp hai thuốc này làm tăng nguy cơ gây chảy máu dạ dày cao hơn khi dùng từng thuốc đơn độc.

Ibuprofen khi dùng đồng thời với aspirin làm tăng nguy cơ gây chảy máu dạ dày. Các nghiên cứu trên động vật cho thấy nồng độ ibuprofen giảm khi dùng đồng thời với aspirin, mặc dù những nghiên cứu trên người còn hạn chế và không thấy sự giảm nồng độ này. Ngoài ra, ibuprofen đối kháng tác dụng ức chế kết tập tiểu cầu không hồi phục của aspirin nên làm giảm tác dụng của aspirin trên tim mạch và làm tăng nguy cơ tim mạch. Liều ibuprofen 400 mg × 3 lần/ngày dùng đồng thời với liều aspirin 81 mg làm giảm tác dụng ức chế hoạt tính của enzym cyclooxygenase-1 của tiểu cầu cũng như tác dụng ức chế kết tập tiểu cầu của aspirin khi dùng aspirin kéo dài. Sử dụng aspirin trước 2 giờ khi dùng liều ibuprofen buổi sáng không tránh được xảy ra tương tác khi dùng chế độ nhiều liều ibuprofen trong ngày, mặc dù thay đổi thời gian sử dụng 2 thuốc có thể tránh được khi dùng chế độ đơn liều ibuprofen trong ngày. Cơ quan quản lý Dược phẩm và Thực phẩm Hoa Kỳ (FDA) khuyến cáo ở bệnh nhân sử dụng liều ibuprofen 400 mg/lần/ngày phối hợp với viên giải phóng ngay lập tức, hàm lượng thấp aspirin, nên sử dụng ibuprofen 8 giờ trước hoặc ít nhất 30 phút sau khi dùng aspirin. Do nguy cơ tăng ADR nên khuyến cáo không nên dùng đồng thời thuốc chống viêm không steroid với aspirin.

Đã có báo cáo ibuprofen làm tăng nồng độ huyết tương của lithi lên 12 - 67% và giảm thải trừ lithi qua thận. Cơ chế của tương tác này chưa rõ nhưng sự ức chế tổng hợp prostaglandin có thể ảnh hưởng đến sự thải trừ lithi ở thận. Một số nhà lâm sàng khuyến cáo không nên dùng đồng thời lithi với ibuprofen. Tuy nhiên, nếu dùng đồng thời phải theo dõi chặt chẽ các dấu hiệu ngộ độc lithi và nồng độ

huyết tương của lithi phải được theo dõi khi bắt đầu sử dụng đồng thời hai thuốc và hiệu chỉnh các liều tiếp theo. Có thể phải giảm liều lithi ở một số bệnh nhân và cần hiệu chỉnh liều lithi khi ngừng dùng ibuprofen.

Có một số bằng chứng về hiệp đồng tác dụng ức chế prostaglandin khi dùng đồng thời ibuprofen với các thuốc ức chế enzym chuyển hay đối kháng thụ thể angiotensin II làm giảm hiệu quả của các nhóm thuốc này trên huyết áp. Phải theo dõi chặt chẽ huyết áp khi phối hợp thuốc NSAID ở bệnh nhân đang dùng ức chế enzym chuyển hay chẹn thụ thể angiotensin II. Có ít dữ liệu về việc gây giảm chức năng thận cấp tính khi phối hợp thuốc chống viêm không steroid và thuốc ức chế enzym chuyển, tuy nhiên không thể loại trừ nguy cơ này vì mỗi nhóm thuốc khi dùng đơn độc đều gây ADR này.

Sử dụng đồng thời corticoid và thuốc chống NSAID làm tăng nguy cơ loét dạ dày.

Ibuprofen và các thuốc chống viêm không steroid khác làm tăng ADR của các kháng sinh nhóm quinolon lên hệ TKTW và có thể dẫn đến co giật.

Magnesi hydroxyd làm tăng sự hấp thu ban đầu của ibuprofen; nhưng nếu nhôm hydroxyd cùng có mặt thì lại không có tác dụng này.

Với các thuốc chống viêm không steroid khác: Tăng nguy cơ chảy máu và gây loét.

Methotrexat: Ibuprofen làm tăng độc tính của methotrexat.

Furosemid, các thiazid: Ibuprofen có thể làm giảm tác dụng bài xuất natri niệu của furosemid và các thuốc lợi tiểu.

Digoxin: Ibuprofen có thể làm tăng nồng độ digoxin huyết tương.

Tương kỵ

Không truyền dung dịch thuốc tiêm ibuprofen cùng đường truyền với các dung dịch nuôi dưỡng nhân tạo.

Không nên hòa trộn dung dịch thuốc tiêm ibuprofen với bất cứ dung dịch nào trừ dung dịch glucose và natri clorid.

Quá liều và xử trí

Có ít thông tin về xảy ra độc tính cấp với ibuprofen. ADR do quá liều ibuprofen thường phụ thuộc vào lượng thuốc uống và thời gian uống. Tuy nhiên vì sự đáp ứng với thuốc là khác nhau nên quá liều phải đánh giá trên từng cá thể.

Các triệu chứng về quá liều ibuprofen đã được báo cáo gồm: đau bụng, buồn nôn, nôn, thờ ơ và ngủ gà, có thể xảy ra đau đầu, con co cứng, ức chế TKTW, co giật, hạ huyết áp, nhịp nhanh, thờ nhanh và rung nhĩ. Có báo cáo nhưng hiếm về nhiễm toan chuyển hóa, hôn mê, suy thận cấp, tăng kali huyết, ngừng thở (chủ yếu ở trẻ nhỏ), ức chế hô hấp và suy hô hấp. Có sự liên quan rất ít giữa nồng độ ibuprofen trong máu và các phản ứng nghiêm trọng xảy ra khi quá liều ibuprofen.

Ở trẻ em tính liều theo trọng lượng cơ thể có thể giúp dự đoán trước nguy cơ độc tính nhưng nên đánh giá trên từng cá thể. Một nhà sản xuất và một số nhà lâm sàng khuyến cáo rằng liều dưới 100 mg/kg ít xảy ra độc tính ở trẻ em. Liều 100 - 400 mg/kg cần uống khi đói và theo dõi trẻ tại cơ sở y tế 4 giờ sau khi uống thuốc. Với liều trên 400 mg/kg cần can thiệp bằng thuốc ngay lập tức, theo dõi chặt chẽ, điều trị hỗ trợ, không khuyến cáo sử dụng các thuốc gây nôn do nguy cơ gây co giật và hít vào dạ dày.

Thường là điều trị triệu chứng và hỗ trợ. Nếu đã uống quá liều thì cần áp dụng những biện pháp sau đây nhằm tăng đào thải và bất hoạt thuốc: rửa dạ dày, gây nôn và lợi tiểu, cho uống than hoạt hay thuốc tẩy muối. Nếu nặng: thẩm tách máu hoặc truyền máu. Vì thuốc gây toan hóa và đào thải qua nước tiểu nên về lý thuyết sẽ có lợi khi cho truyền dịch kiềm và lợi tiểu. Cần phải theo dõi, kiểm soát nguy cơ hạ huyết áp, chảy máu dạ dày và toan hóa máu.

Cập nhật lần cuối: 2017.

IDARUBICIN HYDROCLORID

Tên chung quốc tế: Idarubicin hydrochloride.

Mã ATC: L01DB06.

Loại thuốc: Chống ung thư loại anthracyclin bán tổng hợp.

Dạng thuốc và hàm lượng

Dung dịch tiêm vô khuẩn đẳng trương, màu đỏ cam, không chứa chất bảo quản, có pH 3,5 với nồng độ 1 mg/ml. Lọ 5 ml, 10 ml, 20 ml.

Thuốc bột để tiêm (dùng 1 lần): 5 mg, 10 mg, 20 mg.

Viên nang: 5 mg, 10 mg.

Dược lực học

Idarubicin hydroclorid (4-demethoxy daunorubicin) là dẫn xuất bán tổng hợp của anthracyclin, có hoạt tính chống ung thư. Cơ chế tác dụng chính xác của thuốc chưa được chứng minh đầy đủ. Idarubicin được cho là xen vào giữa các cặp base của DNA, có tác dụng ức chế tổng hợp acid nucleic, tương tác với topoisomerase II và cũng tương tác với màng tế bào và làm biến đổi chức năng màng; điều này có thể góp một phần quan trọng trong cả tác dụng chống ung thư và gây độc cho tim của thuốc. Trong cấu trúc anthracyclin của idarubicin, không có nhóm methoxy ở vị trí 4, nên thuốc có ái lực cao với lipid và do đó tăng khả năng thâm nhập vào tế bào so với các anthracyclin khác.

Dược động học

Khác với các anthracyclin khác (doxorubicin, daunorubicin), idarubicin sau khi uống được hấp thu rất nhanh ở ống tiêu hóa. Sinh khả dụng khác nhau trên mỗi người bệnh.

Idarubicin được phân bố nhanh với thể tích phân bố rất cao, điều đó chứng tỏ thuốc gắn mạnh vào mô. Nồng độ đỉnh trong các tế bào có nhân của máu ngoại vi và trong tủy xuất hiện trong vòng vài phút sau khi tiêm thuốc vào tĩnh mạch và cao gấp hơn một trăm lần nồng độ trong huyết tương. Idarubicin bị enzym aldoketoreductase chuyển hóa thành idarubicinol là chất chuyển hóa chính, có hoạt tính. Idarubicin và idarubicinol gắn vào protein huyết tương với tỷ lệ tương ứng là 97% và 94%. Nồng độ idarubicin và chất chuyển hóa có hoạt tính trong dịch não tủy đã được định lượng, nhưng kết quả đang cần được đánh giá về mặt lâm sàng. Không rõ idarubicin và các chất chuyển hóa có vào sữa hay không.

Độ thanh thải huyết tương gấp 2 lần lưu lượng máu dự kiến qua gan, chứng tỏ thuốc chuyển hóa ngoài gan mạnh.

Tốc độ đào thải idarubicin ra khỏi huyết tương chậm, với nửa đời cuối ước tính trung bình 22 giờ (phạm vi: 4 - 48 giờ) khi dùng đơn độc và 20 giờ (phạm vi: 7 - 38 giờ) khi dùng phối hợp với cytarabin. Chất chuyển hóa idarubicinol được đào thải chậm hơn nhiều so với idarubicin, nửa đời thải trừ cuối trên 45 giờ, do đó nồng độ idarubicinol trong huyết tương được duy trì trên 8 ngày sau khi tiêm tĩnh mạch idarubicin. Tốc độ biến mất của idarubicin trong huyết tương và trong tế bào tương tự như nhau, với nửa đời cuối khoảng 15 giờ. Nửa đời cuối của idarubicinol trong tế bào là khoảng 72 giờ.

Idarubicinol cũng có hoạt tính độc tế bào nên có thể góp phần vào tác dụng của idarubicin.

Ở người rối loạn chức năng gan vừa hoặc nặng, chuyển hóa idarubicin có thể bị rối loạn và dẫn đến nồng độ thuốc toàn thân cao hơn. Suy thận cũng có thể ảnh hưởng lên đào thải thuốc.

Thuốc được đào thải chủ yếu qua mật và ở mức độ ít hơn qua thận, phần lớn dưới dạng idarubicinol.

Chỉ định

Idarubicin được chỉ định dùng với các thuốc khác để điều trị bệnh bạch cầu cấp dòng tủy ở người lớn (bao gồm cả bệnh bạch cầu cấp tiền tủy bào) và dùng trong điều trị bệnh bạch cầu cấp dòng lympho