

tiểu cầu < 100 000/mm<sup>3</sup> và/hoặc số lượng tiểu cầu giảm xuống 30 - 50% giữa hai lần thử. Giảm tiểu cầu typ II chủ yếu xuất hiện vào ngày thứ 5 đến ngày thứ 21 sau khi điều trị, thường gặp nhiều nhất vào ngày thứ 10, nhưng cũng có khi sớm hơn hoặc muộn hơn. Phải theo dõi chức năng thận ở người cao tuổi hoặc có suy thận nhẹ hoặc vừa. Nếu thấy Cl<sub>cr</sub> < 30 ml/phút tính theo công thức Cockcroft thì ngừng nadroparin và thay thế bằng heparin thông thường (không phân đoạn).

**Liều lượng và cách dùng**

Người lớn: Liều dùng được tính theo đơn vị IU kháng Xa.

*Chú ý:* Các biệt dược của heparin khối lượng phân tử thấp đều có nồng độ biểu thị bằng đơn vị quốc tế kháng Xa, nhưng các thuốc có thể khác nhau về quá trình điều chế, phân bố khối lượng phân tử, hoạt tính kháng Xa và kháng IIa. Vì vậy không thể hoán đổi (đơn vị với đơn vị) giữa các heparin không phân đoạn và cả giữa các heparin khối lượng phân tử thấp. Cần đọc kỹ hướng dẫn sử dụng của mỗi biệt dược và tuân thủ cách dùng riêng của từng biệt dược khi thay đổi điều trị.

**Cách dùng**

Tiêm dưới da (trừ khi có chỉ định thẩm tách máu), không được tiêm bắp. Dùng cho người lớn.

Kỹ thuật tiêm dưới da: Tiêm ngập kim thẳng đứng vào nếp da gấp bụng vùng thắt lưng trước - bên và sau - bên giữa ngón cái và ngón trỏ của người tiêm. Phải duy trì nếp gấp trong suốt thời gian tiêm. Phải thay đổi vị trí tiêm, lúc bên phải lúc bên trái. Không chà xát vào vị trí tiêm. Trong bơm tiêm đã đóng thuốc có thể có bọt khí, không cần cố gắng loại bỏ bọt khí trước khi tiêm vì có thể làm mất thuốc.

**Liều lượng**

Người lớn:

*Dự phòng bệnh huyết khối tĩnh mạch sâu*

*Trong phẫu thuật chung:* Liều khuyến cáo là 2 850 IU kháng Xa nadroparin calci tiêm dưới da mỗi ngày 1 lần trong ít nhất 7 ngày hoặc cho tới khi người bệnh đi lại được. Mũi tiêm đầu tiên được thực hiện 2 - 4 giờ trước khi phẫu thuật.

*Dự phòng ở bệnh nhân nằm bất động do bệnh cấp tính hoặc nhập viện ở khoa điều trị tích cực:* Tiêm dưới da mỗi ngày một lần. Bắt đầu trong vòng 12 - 24 giờ sau khi bệnh nhân nhập viện và có khả năng cần nằm tại giường ít nhất 3 ngày. Thời gian điều trị tối đa là 28 ngày. Ở người < 70 kg, liều là 3 800 IU kháng Xa và liều là 5 700 IU kháng Xa ở người > 70 kg.

*Trong phẫu thuật chỉnh hình (khớp háng, đầu gối):* Liều được điều chỉnh theo cân nặng. Liều đầu tiên là 38 IU kháng Xa/kg (khoảng 1900 IU kháng Xa cho người cân nặng 40 - 60 kg) vào 12 giờ trước khi phẫu thuật; liều thứ hai 12 giờ sau khi phẫu thuật kết thúc; sau đó mỗi ngày một lần và liều được tăng lên khoảng 50% kể từ ngày thứ tư (57 IU kháng Xa/kg/ngày). Tổng thời gian điều trị phải ít nhất 10 ngày.

*Điều trị huyết khối tĩnh mạch sâu:* Nadroparin calci tiêm dưới da liều 86 IU kháng Xa/kg cách 12 giờ/1 lần, hoặc liều 171 IU kháng Xa/kg tiêm mỗi ngày 1 lần, cho tới 10 ngày. Ở người bị tăng đông máu (thrombophilia) hoặc huyết khối tĩnh mạch sâu phức tạp hoặc tăng nguy cơ biến chứng xuất huyết, nên sử dụng dạng dùng 2 lần/ngày.

*Dự phòng đông máu trong thẩm phân máu kéo dài dưới 4 giờ:* Tiêm nadroparin calci vào đường động mạch của mạch thẩm tách lúc bắt đầu thẩm tách. Liều thông thường là 2 850 IU kháng Xa cho người bệnh cân nặng < 50 kg, 3 800 IU kháng Xa cho người cân nặng từ 50 - 69 kg, 5 700 IU kháng Xa cho người ≥ 70 kg. Phải giảm liều đối với người bệnh có nguy cơ xuất huyết (giảm một nửa liều). Nếu thẩm phân dài hơn 4 giờ, có thể thêm một liều thấp nadroparin trong quá trình thẩm phân, điều chỉnh liều tùy theo đáp

ứng của bệnh nhân.

Khi thận suy, thải trừ nadroparin bị kéo dài. Vì vậy cần giảm liều trong trường hợp suy thận vừa và nặng.

*Điều trị hội chứng vành cấp (đau thắt ngực không ổn định và nhồi máu cơ tim không có sóng Q):* Tiêm tĩnh mạch một liều ban đầu 86 IU kháng Xa/kg (tối đa 9 500 IU), tiếp theo là tiêm dưới da 86 IU kháng Xa/kg (tối đa 9 500 IU) sau mỗi 12 giờ cho tới khoảng 6 ngày. Phải phối hợp với aspirin liều thấp.

**Tương tác thuốc**

Tránh dùng cùng các thuốc có thể gây tăng kali huyết như thuốc lợi tiểu giữ kali, muối kali, thuốc ức chế enzym chuyển, thuốc ức chế angiotensin II, NSAID, ciclosporin, trimethoprim, tacrolimus...

Thận trọng khi dùng cùng corticosteroid đường toàn thân, dextran. Trong dự phòng huyết khối tĩnh mạch sâu với phẫu thuật chung và phẫu thuật chỉnh hình, dự phòng đông máu trong thẩm phân máu, điều trị huyết khối tĩnh mạch sâu, không khuyến cáo phối hợp với aspirin và dẫn chất salicylat, NSAID, ticlopidin và các thuốc chống kết tập tiểu cầu khác vì tăng nguy cơ xuất huyết. Trường hợp cần thiết phải dùng, theo dõi thận trọng trên lâm sàng và các chỉ số đông máu.

**Quá liều và xử trí**

*Triệu chứng:* Xuất huyết là dấu hiệu lâm sàng chủ yếu của quá liều nadroparin calci.

*Xử trí:* Cần theo dõi số lượng tiểu cầu và các chỉ số đông máu khác. Trường hợp nhẹ, có thể giảm liều hoặc tạm ngưng một vài liều. Trường hợp quá liều nhiều phải ngừng dùng thuốc ngay, ít nhất là ngừng tạm thời. Trường hợp rất nặng phải dùng protamin do tác dụng chống đông máu của nadroparin bị protamin ức chế. Dùng khoảng 6 mg protamin sulfat đường tĩnh mạch để trung hoà khoảng 0,1 ml (950 IU kháng Xa). Hoạt tính kháng Xa không bao giờ bị trung hòa hoàn toàn.

*Cập nhật lần cuối: 2021.*

**NALOXON**

**Tên chung quốc tế:** Naloxone hydrochloride.

**Mã ATC:** V03AB15.

**Loại thuốc:** Thuốc đối kháng opiat; thuốc giải độc opiat.

**Dạng thuốc và hàm lượng**

Dung dịch xịt mũi (dạng muối hydroclorid): 4 mg/0,1 ml.

Ống tiêm (dạng muối hydroclorid): 0,04 mg/2 ml; 0,4 mg/1 ml; 4 mg/10 ml.

Ống tiêm không có chất bảo quản (dạng muối hydroclorid): 0,4 mg/1 ml; 2 mg/2 ml.

Bơm tiêm đóng sẵn (dạng muối hydroclorid): 2 mg/2 ml.

Bơm tiêm tự động (dạng muối hydroclorid): 0,4 mg/1 ml; 0,8 mg/2 ml; 2 mg/5 ml.

Viên nén kết hợp với pentazocin: 0,5 mg naloxon hydroclorid + 50 mg pentazocin hydroclorid.

Viên ngậm dưới lưỡi: 0,5 mg naloxon hydroclorid ngậm 2 phân tử nước + 2 mg buprenorphin hydroclorid; 2 mg naloxon hydroclorid ngậm 2 phân tử nước + 8 mg buprenorphin hydroclorid.

**Được lực học**

Naloxon hydroclorid là một chất bán tổng hợp, dẫn xuất từ thebain, là chất đối kháng opiat đặc hiệu có tác dụng cạnh tranh tại các thụ thể opiat trong hệ thần kinh trung ương, được coi là có ái lực cao nhất đối với thụ thể μ. Ngược lại với levalorphan hoặc nalorphan, naloxon ít hoặc không có hoạt tính chủ vận. Khi dùng với liều bình thường cho người bệnh gần đây không dùng opiat, naloxon ít hoặc



không có tác dụng dược lý. Ngay cả liều rất cao (10 lần liều điều trị thường dùng) gây giảm đau không đáng kể, chỉ gây ngủ lơ mơ, và không gây tác dụng ức chế hô hấp, rối loạn tâm thần, thay đổi về tuần hoàn, hoặc co đồng tử.

Ở người bệnh đã dùng liều lớn morphin hoặc thuốc giảm đau khác có tác dụng giống morphin, naloxon đối kháng phần lớn những tác dụng của opiat. Tăng tần số thở và tăng thể tích thở ra trong một phút, phân áp CO<sub>2</sub> động mạch giảm xuống mức bình thường và huyết áp (nếu giảm) trở về bình thường. Khác với nalorphin hoặc levalorphan, naloxon làm giảm ức chế hô hấp nhẹ gây ra do opiat liều thấp. Vì thời gian tác dụng của naloxon thường ngắn hơn của opiat, nên tác dụng của opiat có thể trở lại khi tác dụng của naloxon hết. Naloxon đối kháng với tác dụng an thần hoặc gây ngủ của opiat. Ý kiến còn chưa thống nhất về vấn đề naloxon có hoặc không làm thay đổi tác dụng gây hưng phấn hoặc co giật của opiat. Naloxon không gây quen thuốc hoặc không gây nghiện về mặt thể chất hoặc tâm lý. Mặc dù liều 0,4 mg naloxon hydroclorid tiêm dưới da có thể thúc đẩy những triệu chứng cai thuốc nặng tiềm tàng ở người bệnh nghiện lệ thuốc về mặt thể chất với chế phẩm opiat hoặc pentazocin, uống naloxon thường không thúc đẩy những triệu chứng này, trừ khi liều uống vượt quá 10 mg. Ngay cả liều uống 30 mg naloxon cũng thường chỉ gây những triệu chứng cai thuốc rất nhẹ.

**Dược động học**

**Hấp thu:** Naloxon bị khử hoạt tính nhanh sau khi uống. Mặc dù thuốc có tác dụng khi uống, nhưng phải uống liều lớn hơn nhiều so với liều tiêm cần thiết để có đối kháng hoàn toàn. Sinh khả dụng dạng xịt mũi 4 mg/0,1 ml bằng 43 - 54% sinh khả dụng của thuốc khi tiêm bắp 0,4 mg.

Naloxon bắt đầu có tác dụng trong vòng 1 - 2 phút sau khi tiêm tĩnh mạch, trong vòng 2 - 5 phút sau khi tiêm dưới da hoặc tiêm bắp, sau 8 - 13 phút khi dùng dạng xịt mũi qua ống nội khí quản. Thời gian duy trì tác dụng phụ thuộc vào liều và đường dùng thuốc. Tiêm bắp tác dụng kéo dài hơn so với tiêm tĩnh mạch. Trong một nghiên cứu, thời gian tác dụng kéo dài 45 phút sau khi tiêm tĩnh mạch naloxon hydroclorid 0,4 mg ở một người nặng 70 kg.

Trong một nghiên cứu ở trẻ sơ sinh, sau khi tiêm vào tĩnh mạch rốn 35 hoặc 70 microgam naloxon hydroclorid, nồng độ đỉnh huyết tương của naloxon xuất hiện trong vòng 40 phút và tương ứng là 4 - 5,4 nanogam/ml và 9,2 - 20,2 nanogam/ml. Trong cùng nghiên cứu đó, sau khi tiêm bắp 0,2 mg cho trẻ sơ sinh, nồng độ đỉnh huyết tương của naloxon xuất hiện trong vòng 0,5 - 2 giờ và đạt 11,3 - 34,7 nanogam/ml.

**Phân bố:** Sau khi tiêm, naloxon phân bố nhanh vào các mô và dịch của cơ thể. Ở chuột cống, thấy có nồng độ cao trong não, thận, lách, phổi, tim, cơ và xương. Naloxon liên kết yếu với protein huyết tương (chủ yếu là albumin) và dễ dàng qua nhau thai. Không rõ naloxon có phân bố vào sữa mẹ hay không.

**Chuyển hóa:** Naloxon chuyển hóa nhanh trong gan, chủ yếu bằng cách liên hợp với acid glucuronic. Chất chuyển hóa chủ yếu là naloxon 3-glucuronid. Naloxon cũng bị khử N-alkyl và khử nhóm 6-ceto, sau đó liên hợp với acid glucuronic.

**Thải trừ:** Nửa đời trong huyết tương của naloxon là 30 - 81 phút ở người lớn và khoảng 3 giờ ở trẻ sơ sinh. 25 - 40% liều uống hoặc tiêm tĩnh mạch được bài tiết dưới dạng chất chuyển hóa qua nước tiểu trong 6 giờ, khoảng 50% trong 24 giờ và 60 - 70% trong 72 giờ.

**Chỉ định**

Quá liều thuốc giảm đau opiat.

Ức chế hô hấp khi dùng thuốc giảm đau opiat liều điều trị.

Ức chế hô hấp do sử dụng thuốc giảm đau opiat trong khi phẫu thuật.

**Chống chỉ định**

Mẫn cảm với naloxon.

**Thận trọng**

Khi dùng naloxon điều trị quá liều opiat gây độc cấp, vì thời gian tác dụng của một số opiat có thể dài hơn của naloxon nên phải theo dõi sát người bệnh và dùng một số liều naloxon nhắc lại. Phải có sẵn biện pháp hồi sức khác (ví dụ, duy trì thông khí đầy đủ, hô hấp nhân tạo, ép tim ngoài lồng ngực, thuốc tăng huyết áp) để sử dụng khi cần thiết.

Sau khi dùng các opiat trong khi phẫu thuật, phải tránh dùng liều naloxon quá cao, vì có thể dẫn đến kích thích, tăng huyết áp và mất tác dụng giảm đau là tác dụng chủ yếu trong lâm sàng. Làm mất tác dụng của opiat quá nhanh có thể gây buồn nôn, nôn, ra mồ hôi, run, nhịp tim nhanh, tăng huyết áp, động kinh, nhịp nhanh thất và rung thất, phù phổi và ngừng tim, dẫn đến tử vong.

Phải dùng thận trọng naloxon cho người bệnh đã biết rõ hoặc nghi ngờ lệ thuốc opiat về mặt thể chất (kể cả những trẻ mới sinh từ bà mẹ nghiện opiat), đặc biệt ở những người có bệnh tim mạch, vì naloxon có thể thúc đẩy những triệu chứng nặng trong lúc cai nghiện.

Phải dùng thận trọng naloxon cho người bệnh có bệnh tim mạch từ trước hoặc những người đang dùng thuốc có khả năng độc với tim, vì ADR về tim phổi nghiêm trọng (ví dụ, nhịp nhanh thất và rung thất, phù phổi, ngừng tim) dẫn đến tử vong, hôn mê và bệnh não đã xảy ra ở những người bệnh hậu phẫu, đã dùng naloxon sau khi phẫu thuật.

Vì thời gian tác dụng của một số opiat có thể dài hơn naloxon, nên cần theo dõi cẩn thận người bệnh đang dùng naloxon; đối với trẻ em dùng naloxon phải theo dõi cẩn thận trong thời gian tối thiểu 24 giờ. Đối với những người bệnh này, khi cần thiết cần phải dùng liều naloxon nhắc lại.

Cần thận trọng khi dùng naloxon cho những người suy thận hoặc suy gan.

**Thận trọng ở trẻ em:** An toàn và hiệu lực của naloxon trong điều trị huyết áp thấp do sốc nhiễm khuẩn ở trẻ em chưa được xác định. Trong một nghiên cứu điều trị naloxon cho 2 trẻ sơ sinh bị sốc nhiễm khuẩn, đã cho đáp ứng dương tính về huyết áp; tuy nhiên một trẻ sơ sinh sau đó bị tử vong sau những cơn động kinh.

**Thận trọng ở người cao tuổi:** Chưa đủ số lượng người bệnh tuổi từ 65 trở lên được nghiên cứu, nên chưa xác định được sự đáp ứng khác nhau giữa người cao tuổi và người trẻ tuổi. Nhưng thông thường đối với người bệnh cao tuổi nên thăm dò cẩn thận liều lượng naloxon, thường bắt đầu điều trị với liều ở giới hạn thấp nhất. Cũng cần lưu ý đến việc người cao tuổi hay bị suy giảm chức năng gan, thận và/hoặc tim và có bệnh kèm theo.

**Thời kỳ mang thai**

Ở người, naloxon qua nhau thai dễ dàng. Cho tới nay, chưa có nghiên cứu và kiểm tra đầy đủ về dùng naloxon ở người mang thai. Chỉ nên dùng naloxon cho người mang thai khi thật cần thiết. Cần cân nhắc nguy cơ lợi hại trước khi dùng naloxon cho người mẹ mang thai đã biết hoặc nghi ngờ bị nghiện opiat, vì mẹ nghiện thường con cũng bị. Naloxon qua nhau thai và có thể thúc đẩy hội chứng cai thuốc ở thai nhi cũng như ở người mẹ.

**Thời kỳ cho con bú**

Vì không biết naloxon có bài tiết vào sữa mẹ không, cần thận trọng khi dùng naloxon cho người cho con bú. Cách xử lý an toàn nhất là không nên cho con bú trong thời gian dùng thuốc.



**Tác dụng không mong muốn (ADR)**

Làm mất đột ngột tác dụng ức chế của opiat có thể dẫn đến buồn nôn, nôn, ra mồ hôi, nhịp tim nhanh, tăng huyết áp, run, co giật, nhịp nhanh thất và rung thất, phù phổi và ngừng tim dẫn đến tử vong. Ở người bệnh sau mổ, dùng liều naloxon lớn hơn mức cần thiết có thể dẫn đến mất tác dụng giảm đau và gây kích thích. Giảm huyết áp, tăng huyết áp, nhịp nhanh thất và rung thất, phù phổi đã xảy ra do dùng naloxon sau khi mổ.

**Thường gặp**

Hô hấp: khó thở, thở sâu nhanh.

Tim mạch: tăng huyết áp, giảm huyết áp, nhịp tim nhanh, loạn nhịp thất.

TKTW: mất ngủ, đau đầu, chóng mặt, buồn ngủ, trầm cảm, đờ đẫn, thiếu khả năng tập trung, lo âu, triệu chứng cai nghiện đối với opiat (những tác dụng này thường xuất hiện trong mấy ngày đầu cho uống liều cao naloxon để điều trị nghiện opiat và nhanh chóng giảm đi khi tiếp tục điều trị hoặc giảm liều).

Da: phát ban.

Tiêu hóa: buồn nôn, nôn, chán ăn.

Mắt: nhìn mờ.

**Ít gặp**

Tiêu hóa: tiêu chảy, khô miệng.

TKTW: bổi rối, dễ bị kích thích, dị cảm.

Khác: vã mồ hôi, run.

**Hiếm gặp**

TKTW: động kinh.

Da: ban đỏ đa hình (nhanh chóng hết sau khi ngừng naloxon).

**Hướng dẫn cách xử trí ADR**

Những ADR của naloxon có thể giảm bớt sau khi giảm bớt liều hoặc ngừng dùng thuốc.

**Liều lượng và cách dùng**

**Cách dùng**

Naloxon hydroclorid thường được tiêm tĩnh mạch hoặc truyền tĩnh mạch qua máy bơm, nhưng cũng có thể tiêm bắp, tiêm dưới da, đôi khi qua ống nội khí quản. Nên dùng đường tĩnh mạch trong trường hợp cấp cứu.

**Liều lượng**

**Quá liều thuốc giảm đau opiat:**

Người lớn:

Tiêm tĩnh mạch, tiêm bắp hoặc tiêm dưới da với 0,4 - 2 mg và lặp lại nếu cần, cách nhau 2 - 3 phút. Có thể dùng liều thấp hơn (0,1 - 0,2 mg) cho bệnh nhân lệ thuộc opiat. Sau khi có đáp ứng thuốc thì có thể lặp lại liều cách nhau 20 - 60 phút tùy thuộc vào loại và khoảng thời gian sử dụng opiat. Nếu không đáp ứng sau tổng liều 10 mg, phải xem lại quá liều do thuốc khác, không phải do thuốc opiat.

Xịt mũi qua ống nội khí quản: Liều 4 mg, có thể lặp lại cứ sau 2 - 3 phút.

Trẻ em: Ưu tiên tiêm tĩnh mạch, có thể tiêm bắp hoặc tiêm dưới da.

Tiêm tĩnh mạch: Trẻ sơ sinh và trẻ em < 5 tuổi hoặc ≤ 20 kg: 0,1 mg/kg (tối đa 2 mg), cứ sau 2 - 3 phút lặp lại một lần nếu cần thiết. Trẻ em ≥ 5 tuổi hoặc > 20 kg: 2 mg, nếu không đáp ứng thì cứ sau 2 - 3 phút lặp lại một lần.

Tiêm dưới da hoặc tiêm bắp: Khởi đầu 0,01 mg/kg/liều, nếu không đáp ứng thì tiêm tiếp liều 0,1 mg/kg/liều (cần chia nhỏ liều để tiêm). Với bơm tiêm tự động thì dùng 0,4 mg hoặc 2 mg/lần, cứ sau 2 - 3 phút lặp lại một lần nếu cần thiết.

Xịt mũi qua ống nội khí quản: 4 mg, cứ sau 2 - 3 phút lặp lại một lần đến khi có liệu pháp can thiệp khác.

**Ức chế hô hấp khi dùng thuốc giảm đau opiat liều điều trị:**

Người lớn: Tiêm tĩnh mạch chậm 0,02 - 0,2 mg.

Trẻ sơ sinh và trẻ em: Tiêm tĩnh mạch chậm đến khi có tác dụng 0,001 - 0,015 mg/kg hoặc tiêm tĩnh mạch liều khởi đầu 0,005 - 0,01 mg và cứ sau 2 - 3 phút lặp lại một lần nếu cần thiết.

**Ức chế hô hấp do sử dụng thuốc giảm đau opiat trong khi phẫu thuật:**

Người lớn và trẻ em ≥ 12 tuổi: Tiêm tĩnh mạch liều khởi đầu 0,1 - 0,2 mg hoặc 0,0015 - 0,003 mg/kg, cứ sau 2 - 3 phút tiêm tĩnh mạch 0,1 mg hoặc tiêm bắp 0,1 mg cứ sau 1 - 2 giờ.

Trẻ em 1 tháng - 11 tuổi: Tiêm tĩnh mạch 0,001 mg/kg, lặp lại cứ sau 2 - 3 phút nếu cần.

**Tương tác thuốc**

Dùng đồng thời naloxon với những thuốc giảm đau opiat dẫn đến giảm tác dụng của các thuốc.

**Tương kỵ**

Không được trộn lẫn thuốc tiêm naloxon hydroclorid với những chế phẩm chứa bisulfit, metabisulfit, những anion có mạch dài hoặc phân tử lượng cao, hoặc bất cứ dung dịch nào có pH kiềm. Không được cho thêm các thuốc hoặc các chất hóa học vào dung dịch naloxon hydroclorid trừ khi đã xác định được tác dụng của chúng trên độ ổn định hóa học và vật lý của dung dịch naloxon.

**Quá liều và xử trí**

Chưa có kinh nghiệm lâm sàng về quá liều naloxon ở người.

*Cập nhật lần cuối: 2021.*

**NALTREXON**

**Tên chung quốc tế:** Naltrexone.

**Mã ATC:** N07BB04.

**Loại thuốc:** Thuốc giải độc; thuốc đối kháng opiat.

**Dạng thuốc và hàm lượng**

Lọ 380 mg naltrexon (chứa polylactid-co-glycolid) dạng vi cầu để pha hỗn dịch tiêm bắp, tác dụng kéo dài; kèm theo lọ dung môi để pha hỗn dịch, bơm tiêm, 2 kim tiêm có vỏ bọc an toàn.

Viên nén: 25 mg, 50 mg, 100 mg (dạng muối hydroclorid).

**Được lực học**

Naltrexon là thuốc đối kháng đặc hiệu trên thụ thể opiat tương tự naloxon, nhưng tác dụng mạnh hơn naloxon 2 - 9 lần và thời gian tác dụng dài hơn, naltrexon mạnh hơn nalorphin 17 lần và bằng 1/10 lần cyclazocin. Khác với levalorphan và nalorphin, naltrexon thường có ít hoặc không có hoạt tính chủ vận. Trên người gần đây không dùng opiat, naltrexon với liều bình thường, không hoặc có rất ít tác dụng dược lý. Khi uống liều 30 - 50 mg/ngày, naltrexon giảm đau không đáng kể, chỉ gây ngủ nhẹ, không ức chế hô hấp, không gây loạn thần, không làm thay đổi huyết áp.

Trên người trước đó đã dùng liều cao duy nhất hoặc nhắc lại của morphin hoặc các thuốc giảm đau opiat khác, naltrexon làm giảm hoặc gây phong bế hoàn toàn nhưng thuận nghịch các tác dụng dược lý của opiat (ví dụ, phụ thuộc thể chất, giảm đau, sáng khoái, dung nạp). Thuốc đối kháng hầu hết các tác dụng của opiat như ức chế hô hấp, co đồng tử, sáng khoái và sự thèm thuốc, nhưng naltrexol có thể làm mất tác dụng chủ quan (như sáng khoái) nhiều hơn là tác dụng khách quan (như ức chế hô hấp hoặc co đồng tử) của thuốc opiat. Naltrexon không gây lệ thuộc thuốc và không gây quen thuốc. Naltrexon có thể thúc đẩy xuất hiện hội chứng cai thuốc ở mức từ nhẹ đến nặng ở người nghiện opiat hoặc pentazocin. Cũng như naloxon, naltrexon cũng đối kháng các tác dụng loạn thần của các chất chủ vận từng phần của opiat (như pentazocin). Vì thời gian tác dụng của naltrexon có thể ngắn hơn so