

cảm thấy không khỏe), giảm lượng nước tiểu và nước tiểu sẫm màu, khó chịu ở cơ như sưng, mềm hoặc yếu cơ, nhịp tim không bình thường, hoặc nhìn mờ, u ám.

#### Liều lượng và cách dùng

*Bổ sung khẩu phần ăn, liều uống thông thường của nicotinamid như sau:*

Nicotinamid thường dùng kết hợp với các vitamin khác trong chế phẩm để bổ sung khẩu phần ăn.

Người lớn: 13 - 19 mg/ngày, dùng 1 lần hoặc chia thành 2 lần.

Người mang thai và cho con bú, chế độ ăn thiếu dinh dưỡng: 17 - 20 mg/ngày, dùng một lần hoặc chia thành 2 lần.

Trẻ em: 5 - 10 mg/ngày, dùng 1 lần hoặc chia thành 2 lần.

Trong trường hợp không thể dùng thuốc theo đường uống, có thể điều trị bằng nicotinamid theo đường tiêm bắp hoặc truyền tĩnh mạch chậm với liều 25 mg, dùng 2 hoặc hơn 2 lần mỗi ngày. Khi tiêm tĩnh mạch, cần tiêm với tốc độ không quá 2 mg/phút. Tuy nhiên dạng thuốc tiêm thường không có sẵn trên thị trường.

#### Điều trị bệnh pellagra:

Người lớn: Liều uống thông thường là 300 - 500 mg/ngày, chia thành 3 - 10 lần. Tối đa 1 500 mg/ngày. Trẻ em: Liều uống thông thường là 100 - 300 mg/ngày, chia thành 3 - 10 lần.

*Điều trị trứng cá:* Bôi thuốc mỡ lên vùng mặt bị tổn thương ngày 2 lần. Đánh giá kết quả sau 8 - 12 tuần.

#### Tương tác thuốc

Chất ức chế HMG-CoA reductase: Có thể làm tăng nguy cơ tiêu cơ vân.

Thuốc chẹn alpha-adrenergic điều trị tăng huyết áp: Có thể gây hạ huyết áp quá mức.

Thuốc uống hạ đường huyết hoặc insulin: Khẩu phần ăn và/hoặc liều thuốc uống hạ đường huyết hoặc insulin có thể cần phải điều chỉnh.

Thuốc có độc tính với gan: Có thể làm tăng thêm tác hại độc cho gan.  
Carbamazepin: Không nên dùng đồng thời vì gây tăng nồng độ carbamazepin huyết tương dẫn đến tăng độc tính.

Điều trị isoniazid trong thời gian dài có thể ảnh hưởng đến sự chuyển hóa của tryptophan thành niacin và làm tăng nhu cầu niacin.

#### Tương kỵ

Nicotinamid tương kỵ với kiềm và acid mạnh.

#### Quá liều và xử trí

Khi quá liều xảy ra, không có thuốc giải độc đặc hiệu. Gây nôn, rửa dạ dày, điều trị triệu chứng và hỗ trợ.

*Cập nhật lần cuối: 2016.*

## NIFEDIPIN

**Tên chung quốc tế:** Nifedipine.

**Mã ATC:** C08CA05.

**Loại thuốc:** Thuốc chẹn kênh calci nhóm dihydropyridin, tác dụng chọn lọc trên cơ trơn mạch máu.

#### Dạng thuốc và hàm lượng

Viên nang: 5 mg, 10 mg.

Viên nén giải phóng kéo dài: 20 mg, 30 mg, 60 mg và 90 mg.

#### Dược lực học

Nifedipin là thuốc chẹn kênh calci, dẫn xuất 1,4-dihydropyridin. Thuốc ức chế dòng ion calci đi vào trong tế bào thông qua kênh calci chậm, chủ yếu tác động trên cơ tim, cơ trơn động mạch vành và mạch ngoại vi. Tác dụng chính của thuốc là giãn cơ trơn động mạch (bao gồm cả động mạch vành và động mạch ngoại vi).

*Trong điều trị tăng huyết áp:* nifedipin gây giãn mạch ngoại vi, làm

giảm tính trở kháng của mạch do vậy làm giảm huyết áp. Dùng nifedipin dạng giải phóng kéo dài, chế độ liều 1 lần/ngày giúp kiểm soát huyết áp trong 24 giờ.

*Trong điều trị đau thắt ngực:* nifedipin gây giãn mạch vành làm tăng lượng máu trở về tim, vì vậy tăng cung cấp oxygen cho cơ tim, cải thiện tưới máu đến các vùng cơ tim bị thiếu máu. Thuốc làm giảm hậu gánh và giảm sức cản động mạch ngoại vi do đó làm giảm gánh nặng cho tim, giảm nhu cầu về oxy của cơ tim. Thuốc làm giảm co thắt mạch vành, giảm co thắt mạch ngoại vi từ đó có tác dụng điều trị đau thắt ngực.

#### Dược động học

*Hấp thu:* Khi dùng viên nang quy ước, thuốc hấp thu nhanh, gần như hoàn toàn và xuất hiện trong huyết tương sau khi uống khoảng 10 phút, đạt  $C_{max}$  sau khoảng 30 phút. Thuốc chuyển hóa bước 1 nhiều, sinh khả dụng đạt được khi dùng dạng viên nang quy ước khoảng 45 - 56%.

Khi dùng viên giải phóng kéo dài, thuốc cũng hấp thu gần như hoàn toàn. Nồng độ thuốc trong huyết tương tăng dần, đạt được trạng thái cân bằng sau khi uống liều đầu tiên khoảng 6 giờ. Với các liều tiếp theo, nồng độ tiếp tục duy trì và ít dao động trong khoảng thời gian 24 giờ. Chỉ số dao động (tỷ lệ nồng độ đỉnh/nồng độ đáy thuốc trong huyết tương) khi dùng viên nang quy ước, 3 lần/ngày cao gấp 3 lần so với khi dùng viên giải phóng kéo dài, 1 lần/ngày. Ở trạng thái cân bằng, sinh khả dụng của viên nén giải phóng kéo dài bằng khoảng 68 - 86% so với viên nang quy ước.

Thức ăn có thể ảnh hưởng (mặc dù ít) tới tốc độ hấp thu ở giai đoạn đầu của quá trình hấp thu, tuy nhiên không ảnh hưởng tới mức độ hấp thu.

*Phân bố:* Tỷ lệ thuốc liên kết protein huyết tương khoảng 95% (92 - 98%), chủ yếu với albumin. Thuốc có bài tiết vào sữa mẹ.

*Chuyển hóa và thải trừ:* Sau khi hấp thu, thuốc chuyển hóa ở ruột non và gan, chủ yếu thông qua các quá trình oxy hóa tạo thành các chất chuyển hóa không có hoạt tính. Nifedipin thải trừ chủ yếu ở dạng chất chuyển hóa, phần lớn qua thận (khoảng 80%). Khoảng 5 - 15% thuốc thải qua mật vào phân. Tỷ lệ nifedipin còn hoạt tính phát hiện được trong nước tiểu rất thấp, chỉ dưới 0,1%.

Nửa đời thải trừ cuối cùng là 1,7 - 3,4 giờ khi dùng dạng bào chế quy ước.

*Trên bệnh nhân suy thận:* Dược động học không khác biệt đáng kể so với đối tượng khỏe mạnh. Do vậy, không cần chỉnh liều thuốc trên bệnh nhân suy thận.

*Trên bệnh nhân suy gan:* sinh khả dụng tăng, tỷ lệ liên kết protein huyết tương có thể giảm, độ thanh thải toàn phần giảm, nửa đời thải trừ kéo dài rõ rệt. Không nên dùng nifedipin dạng giải phóng kéo dài trên nhóm bệnh nhân này.

#### Chỉ định

Tăng huyết áp (dùng viên giải phóng kéo dài).

Đau thắt ngực ổn định.

Đau thắt ngực Prinzmetal.

#### Chống chỉ định

Tiền sử quá mẫn với nifedipin hoặc các dihydropyridin khác bởi vì theo lý thuyết có thể xảy ra phản ứng chéo.

Đau thắt ngực không ổn định. Con đau thắt ngực cấp. Sốc tim.

Tăng huyết áp ác tính. Hẹp động mạch chủ có ý nghĩa trên lâm sàng. Trong vòng 1 tháng sau nhồi máu cơ tim. Dự phòng thứ phát nhồi máu cơ tim.

Bệnh porphyria cấp.

Bệnh nhân có túi Kock (sau phẫu thuật cắt bỏ hồi tràng). Bệnh viêm ruột hoặc bệnh Crohn.

Sử dụng cùng rifampicin.

**Thận trọng**

Cần thận trọng khi dùng nifedipin trên bệnh nhân có huyết áp rất thấp (hạ huyết áp nặng với huyết áp tâm thu dưới 90 mmHg).

Không dùng viên nang quy ước để giảm huyết áp trên bệnh nhân có cơn tăng huyết áp. Đã có ghi nhận các trường hợp hạ huyết áp quá mức, nhồi máu cơ tim và tử vong xảy ra khi dùng nifedipin dạng viên nang quy ước với mục đích trên. Không dùng nifedipin dạng viên nang quy ước để điều trị tăng huyết áp vô căn.

Trên bệnh nhân có chức năng tim kém, không nên dùng nifedipin vì đã có ghi nhận tình trạng suy tim trầm trọng hơn khi dùng nifedipin.

Trên bệnh nhân thâm tách máu có tăng huyết áp ác tính và giảm thể tích dịch tuần hoàn, hạ huyết áp quá mức có thể xảy ra do tác dụng gây giãn mạch của nifedipin.

Nifedipin không có tác dụng dự phòng hoặc giảm nguy cơ liên quan đến ngừng các thuốc điều trị tăng huyết áp khác. Nifedipin không có tác dụng bảo vệ và giảm thiểu nguy cơ liên quan đến ngừng đột ngột thuốc chẹn beta. Do vậy, không nên ngừng đột ngột, thay vào đó cần giảm liều từ từ các thuốc chẹn beta trước khi khởi đầu điều trị nifedipin.

Trên bệnh nhân có bệnh lý mạch vành mức độ nặng, đã có báo cáo ghi nhận (mặc dù hiếm) về tình trạng tăng số cơn đau thắt ngực, tăng mức độ nặng cơn đau thắt ngực và khởi phát nhồi máu cơ tim khi khởi trị với nifedipin hoặc khi điều chỉnh tăng liều nifedipin.

Đã ghi nhận (mặc dù hiếm) các triệu chứng tắc nghẽn đường tiêu hóa liên quan đến việc sử dụng viên nén nifedipin dạng bào chế giải phóng kéo dài. Tắc nghẽn đường tiêu hóa mức độ nghiêm trọng đã được ghi nhận, một số trường hợp cần phải nhập viện và phẫu thuật.

Trong thời kỳ mang thai, không nên sử dụng nifedipin trừ khi thực sự cần thiết. Chỉ nên dùng nifedipin cho phụ nữ có tăng huyết áp mức độ nặng không đáp ứng với các liệu pháp điều trị chuẩn. Khi dùng nifedipin cùng magesi sulfat đường tĩnh mạch, cần thận trọng và theo dõi chặt chẽ huyết áp vì nguy cơ huyết áp giảm quá mức có thể ảnh hưởng tới cả mẹ và thai nhi.

Trong thời kỳ cho con bú, không khuyến cáo dùng nifedipin do thuốc bài tiết vào sữa mẹ và ảnh hưởng của thuốc trên thai nhi vẫn còn chưa được biết đến đầy đủ.

Trên bệnh nhân suy giảm chức năng gan, sử dụng thận trọng. Cần nhắc giảm liều trên bệnh nhân suy gan nặng.

Thận trọng khi dùng cùng các thuốc ức chế hoặc cảm ứng enzym CYP450 3A4 vì nifedipin chuyển hóa qua hệ enzym này. Cần theo dõi chặt chẽ huyết áp khi dùng cùng các thuốc ức chế CYP3A4.

**Thời kỳ mang thai**

Các nghiên cứu thực nghiệm trên động vật cho thấy nifedipin gây độc với phôi thai, bào thai và gây quái thai. Chưa có các nghiên cứu có đối chứng thực hiện trên người. Các bằng chứng lâm sàng cho tới nay chưa cho thấy nguy cơ cụ thể nào trên thai, tuy nhiên đã cho thấy sự tăng tỷ lệ trẻ ngạt khi sinh, tăng tỷ lệ sinh mổ, tăng tỷ lệ sinh non cũng như gây chậm phát triển của thai nhi trong tử cung. Chưa rõ các ghi nhận này liên quan đến bệnh lý nền tăng huyết áp của bệnh nhân hay là tác dụng của nifedipin. Do các bằng chứng cho tới nay chưa loại trừ các tác dụng có hại của thuốc trên thai nhi và trẻ sơ sinh, cần rất cẩn trọng đánh giá lợi ích nguy cơ trên từng trường hợp và chỉ dùng nifedipin khi thực sự cần thiết (không thể sử dụng các biện pháp điều trị khác hoặc kém đáp ứng với điều trị).

**Thời kỳ cho con bú**

Nifedipin có bài tiết vào sữa mẹ. Nồng độ nifedipin trong sữa mẹ gần như tương đương với nồng độ trong huyết thanh mẹ. Chỉ dùng thuốc khi thật cần thiết trong đó lợi ích được đánh giá vượt trội

nguy cơ. Nếu dùng viên nang quy ước nifedipin trong thời kỳ cho con bú, khuyến cáo trì hoãn cho con bú ít nhất 3 - 4 giờ sau khi uống thuốc để giảm phơi nhiễm nifedipin trên trẻ.

**Tác dụng không mong muốn (ADR)**

Các ADR ghi nhận được từ các thử nghiệm lâm sàng ngẫu nhiên đối chứng bao gồm:

*Thường gặp*

Thần kinh: đau đầu.

Mạch: phù (chủ yếu là phù ngoại biên), triệu chứng của giãn mạch.

Tiêu hóa: táo bón.

Chung: cảm thấy không khỏe.

*Ít gặp*

Miễn dịch: dị ứng, phù mạch bao gồm phù thanh quản.

Tâm thần: lo lắng, rối loạn giấc ngủ.

Thần kinh: chóng mặt, run.

Mắt: rối loạn thị giác.

Tim: nhịp tim nhanh, đánh trống ngực.

Mạch: hạ huyết áp, ngất.

Hô hấp - lồng ngực: chảy máu mũi, sung huyết mũi.

Tiêu hóa: đau bụng, buồn nôn, khó tiêu, đầy hơi, khô miệng.

Gan mật: tăng enzym gan thoáng qua.

Da và mô mềm: ban da.

Cơ xương: chuột rút, sưng khớp.

Thận và tiết niệu: tiểu nhiều, tiểu khó.

Sinh sản: rối loạn cương dương.

Chung: ớn lạnh, đau không rõ nguyên nhân.

*Hiếm gặp*

Miễn dịch: ngứa, mày đay, phát ban.

Tâm thần: thay đổi tâm trạng.

Thần kinh: rối loạn cảm giác.

Khác: tăng sản lợi.

**Hướng dẫn cách xử trí ADR**

Các ADR của nifedipin như chóng mặt, đỏ bừng mặt, đau đầu, hạ huyết áp, phù ngoại vi... thường là do tác dụng giãn mạch của thuốc gây nên.

Một nghịch lý xảy ra trong quá trình điều trị là ở một số người bệnh khi mới bắt đầu điều trị có hiện tượng đau thắt ngực tăng lên do huyết áp giảm đột ngột có thể gây thiếu máu cục bộ ở não, cơ tim và một số người bệnh có thể bị mù thoáng qua. Khi gặp các ADR này thì nên ngừng điều trị ngay. Tuy nhiên các ADR nặng của nifedipin đòi hỏi phải ngừng điều trị hoặc phải giảm liều thường ít gặp.

**Liều lượng và cách dùng**

**Cách dùng:** Đường uống. Cần uống nguyên viên với nước, không nhai, bẻ, nghiền (bao gồm cả viên nang quy ước và viên giải phóng kéo dài). Có thể uống cùng hoặc không cùng thức ăn. Khi dùng dạng bào chế giải phóng kéo dài với chế độ liều 1 lần/ngày, tốt nhất nên uống vào buổi sáng và cố định thời điểm uống giữa các ngày. Không dùng cùng nước ép bưởi chùm.

**Liều lượng**

*Tăng huyết áp:*

Dạng giải phóng kéo dài: Liều khởi đầu 1 viên 20 mg, 30 mg hoặc 60 mg/lần/ngày. Tăng dần liều tùy theo đáp ứng của từng bệnh nhân, tới tối đa 90 mg/lần, 1 lần/ngày hoặc 40 mg/lần, 2 lần/ngày. Không khuyến cáo dùng liều tới 120 mg/ngày.

*Đau thắt ngực:*

Dạng viên nang quy ước: Liều khởi đầu 1 viên 10 mg/lần, 3 lần/ngày (uống nguyên viên). Khoảng liều thông thường có hiệu quả là 10 - 20 mg/lần, 3 lần/ngày. Trên một số bệnh nhân, đặc biệt các bệnh nhân đau thắt ngực do co thắt thường chỉ đáp ứng khi dùng

liều cao hơn hoặc số lần đưa thuốc nhiều hơn. Liều có thể hiệu quả trên các bệnh nhân này là 20 - 30 mg/lần, 3 - 4 lần/ngày. Hiếm khi cần tới liều hàng ngày từ 120 mg trở lên. Không khuyến cáo dùng liều hơn 180 mg/ngày.

Dạng giải phóng kéo dài: Liều khởi đầu 1 viên 30 mg/lần, 1 lần/ngày. Có thể tăng dần liều tùy theo đáp ứng của từng bệnh nhân tới tối đa là 90 mg/lần, 1 lần/ngày.

Lưu ý khoảng thời gian giữa hai lần chỉnh liều nên khoảng 7 - 14 ngày sau khi đã đánh giá đáp ứng đầy đủ của bệnh nhân với chế độ liều trước đó và theo dõi huyết áp của bệnh nhân trước khi chuyển sang chế độ liều tiếp theo. Tuy nhiên, do nồng độ thuốc trong huyết tương đạt được trạng thái cân bằng ở ngày thứ 2 dùng liều khởi đầu hoặc liều sau hiệu chỉnh) có thể hiệu chỉnh liều nhanh hơn nếu cần và phải đảm bảo đánh giá thường xuyên bệnh nhân.

Người cao tuổi hoặc bệnh nhân suy giảm chức năng thận: không cần điều chỉnh liều.

### Tương tác thuốc

#### Các thuốc ảnh hưởng tới nifedipin:

Nifedipin chuyển hóa qua CYP3A4 (ở ruột non và gan). Các thuốc ức chế hoặc cảm ứng enzym này có thể ảnh hưởng tới chuyển hóa bước một của nifedipin (sau khi dùng đường uống) và độ thanh thải của nifedipin.

Khi dùng cùng các thuốc ức chế CYP3A4, cần theo dõi huyết áp và cân nhắc giảm liều nifedipin nếu cần thiết. Các thuốc có thể làm tăng nồng độ nifedipin bao gồm: kháng sinh nhóm macrolid (như erythromycin), thuốc ức chế protease điều trị HIV (như ritonavir), thuốc chống nấm (như ketoconazol), fluoxetin, nefazodon, quinopristin/dalfopristin, cisaprid, acid valproic, cimetidin, diltiazem.

Khi dùng cùng các thuốc cảm ứng CYP3A4, cần theo dõi đáp ứng lâm sàng của nifedipin và cân nhắc tăng liều nifedipin nếu cần thiết. Nếu tăng liều nifedipin khi dùng cùng với các thuốc cảm ứng CYP3A4, phải xem xét giảm liều nifedipin khi ngừng dùng các thuốc này. Các thuốc có thể làm giảm nồng độ nifedipin bao gồm: rifampicin, phenytoin, carbamazepin, phenobarbital. Lưu ý, rifampicin cảm ứng mạnh CYP3A4, làm giảm đáng kể sinh khả dụng của nifedipin khi dùng cùng, dẫn tới giảm tác dụng của thuốc. Vì vậy, chống chỉ định phối hợp rifampicin và nifedipin.

#### Các thuốc bị ảnh hưởng bởi nifedipin:

Nifedipin có thể làm tăng tác dụng hạ huyết áp của các thuốc điều trị tăng huyết áp dùng đồng thời.

**Thuốc chẹn beta:** khi dùng đồng thời với thuốc chẹn beta, cần theo dõi bệnh nhân chặt chẽ về nguy cơ bệnh suy tim có thể trầm trọng hơn. Bên cạnh đó, phối hợp có thể có nguy cơ hạ huyết áp quá mức, chậm nhịp tim.

**Digoxin:** độ thanh thải của digoxin có thể giảm, dẫn tới tăng nồng độ digoxin huyết thanh. Cần theo dõi các triệu chứng của quá liều digoxin và giảm liều nếu cần thiết.

**Quinidin:** đã có ghi nhận nồng độ quinidin giảm khi dùng đồng thời với nifedipin và gia tăng sau khi ngừng nifedipin. Do vậy, cần theo dõi nồng độ quinidin (nếu có thể) và điều chỉnh liều quinidin phù hợp (nếu cần thiết) khi bắt đầu dùng hoặc ngừng nifedipin. Theo dõi huyết áp chặt chẽ và giảm liều nifedipin nếu cần thiết.

**Tacrolimus:** tacrolimus chuyển hóa qua CYP3A4. Các dữ liệu công bố hiện tại cho thấy có thể cần phải theo dõi nồng độ tacrolimus và giảm liều tacrolimus khi dùng cùng nifedipin trong một số trường hợp.

**Phenytoin, theophyllin, thuốc giãn cơ không khử cực (như tubocurarin):** Nồng độ các thuốc này có thể tăng khi dùng cùng nifedipin.

#### Tương tác thuốc - thức ăn:

Nước ép bưởi chùm ức chế CYP3A4. Do vậy dùng đồng thời

nifedipin với nước ép bưởi chùm có thể dẫn tới giảm chuyển hóa bước 1, giảm độ thanh thải, tăng nồng độ, tăng tác dụng hạ huyết áp và kéo dài thời gian tác dụng của nifedipin. Nên tránh dùng nước ép bưởi chùm khi đang dùng nifedipin.

### Quá liều và xử trí

**Triệu chứng:** Các triệu chứng khi ngộ độc lượng lớn nifedipin là: Rối loạn ý thức có thể dẫn đến hôn mê, hạ huyết áp, nhịp tim nhanh hoặc nhịp tim chậm, tăng đường huyết, toan chuyển hóa, giảm oxy huyết, sốc tim kèm phù phổi.

**Xử trí:** Khi quá liều nifedipin, cần áp dụng các biện pháp để loại bỏ nifedipin và duy trì chức năng tim mạch. Cân nhắc áp dụng các biện pháp để loại bỏ cả nifedipin ở ruột non để giảm thiểu tối đa hấp thu nifedipin từ hệ tiêu hóa. Lợi ích của rửa dạ dày trong xử trí quá liều nifedipin vẫn chưa chắc chắn.

Xem xét sử dụng than hoạt (50 g với người lớn, 1 g/kg với trẻ em) nếu bệnh nhân tiếp cận với cơ sở y tế trong vòng 1 tiếng từ khi uống quá liều. Sử dụng than hoạt (muộn sau khi uống quá liều) vẫn có thể có lợi ích khi quá liều nifedipin dạng bào chế giải phóng kéo dài.

Xem xét rửa dạ dày (ở người lớn) trong vòng 1 giờ nếu quá liều nghi ngờ đe dọa tính mạng.

Xem xét bổ sung thêm liều than hoạt mỗi 4 giờ và sử dụng liều đơn thuốc nhuận tràng thẩm thấu (như sorbitol, lactulose hoặc magnesi sulfat) nếu bệnh nhân quá liều một lượng lớn các dạng bào chế giải phóng kéo dài.

Trên các bệnh nhân quá liều không có triệu chứng, cần theo dõi bệnh nhân ít nhất 4 giờ sau khi uống và ít nhất 12 giờ nếu uống dạng bào chế giải phóng kéo dài.

Nifedipin không loại trừ được qua thẩm tách, tuy nhiên có thể lọc huyết tương.

Xử trí hạ huyết áp do sốc tim và giãn mạch bằng calci (10 - 20 mg dung dịch calci gluconat 10%). Nếu đáp ứng chưa đầy đủ, tiếp tục bổ sung liều calci và theo dõi chặt chẽ điện tâm đồ. Nếu đáp ứng vẫn chưa đầy đủ khi dùng calci, sử dụng các thuốc cường giao cảm gây co mạch như dopamin hoặc noradrenalin với liều điều chỉnh theo đáp ứng của bệnh nhân.

Xử trí chậm nhịp tim có triệu chứng bằng atropin, thuốc chủ vận beta hoặc đặt máy tạo nhịp tạm thời nếu cần thiết.

Khi bổ sung dịch, cần thận trọng để tránh quá tải dịch.

*Cập nhật lần cuối: 2019.*

## NILOTINIB

**Tên chung quốc tế:** Nilotinib.

**Mã ATC:** L01XE08.

**Loại thuốc:** Chống ung thư, ức chế Bcr-Abl tyrosine kinase.

### Dạng thuốc và hàm lượng

Nang cứng: 150 mg, 200 mg (dùng dạng hydroclorid monohydrat, hàm lượng tính theo dạng base).

### Dược lực học

Bệnh bạch cầu mạn tính dòng tủy (CML) là bệnh rối loạn tăng sinh dòng tủy, đặc trưng bởi sự gia tăng tế bào tạo máu mang nhiễm sắc thể Philadelphia. Do sự chuyển đoạn lẫn nhau của nhánh dài nhiễm sắc thể 9 và 22 tạo thành gen dung hợp Bcr-Abl. Hoạt tính bất thường của Abl tyrosin kinase của gen Bcr-Abl là nguyên nhân dẫn đến CML.

Nilotinib là chất ức chế tyrosin kinase, dẫn xuất aminopyrimidin có tác dụng qua đường uống. Nilotinib ức chế cạnh tranh với Bcr-Abl tại vị trí gắn ATP, dẫn đến ức chế quá trình phosphoryl hóa tyrosin