

và gan, vì vậy người bệnh cần được kiểm tra thường xuyên công thức máu và chức năng gan cho đến khi hồi phục và ít nhất 2 tuần sau đó. Nếu có xuất hiện bất thường nào, cần điều chỉnh ngay.

Cập nhật lần cuối: 2020.

PROGESTERON

Tên chung quốc tế: Progesterone.

Mã ATC: G03DA04.

Loại thuốc: Hormon sinh dục nữ progestin.

Dạng thuốc và hàm lượng

Hàm lượng thuốc được tính theo progesteron dạng tổng hợp.

Dung dịch dầu để tiêm bắp: 50 mg/ml (ống 2 ml, 10 ml).

Viên nang uống: 100 mg, 200 mg.

Gel dùng trong âm đạo: 4%, 8% (kèm dụng cụ chuyên dụng).

Viên đặt âm đạo: 100 mg, 200 mg, 400 mg (kèm dụng cụ chuyên dụng).

Dược lực học

Progesteron là một hormon steroid tự nhiên được tiết ra chủ yếu từ hoàng thể ở nửa sau chu kỳ kinh nguyệt. Progesteron được hình thành từ các tiền chất steroid trong buồng trứng, tinh hoàn, vỏ thượng thận và nhau thai. Hormon tạo hoàng thể (LH) kích thích tổng hợp và bài tiết progesteron từ hoàng thể. Progesteron giúp cho trứng đã thụ tinh làm tổ và phát triển trong tử cung. Hormon thường được tiết ra với nồng độ cao ở giai đoạn sau của thai kỳ. Ở phụ nữ, cùng với lượng estrogen nội sinh, progesteron sẽ làm nội mạc tử cung tăng sinh. Progesteron giảm tiết đột ngột vào cuối chu kỳ kinh nguyệt là nguyên nhân chủ yếu dẫn đến hiện tượng chảy máu kinh nguyệt.

Ngoài ra progesteron còn làm thay đổi sự bài tiết trong nội mạc tử cung, kích thích tuyến vú phát triển, gây giãn cơ trơn tử cung, ngăn cản nang trứng trưởng thành và rụng trứng, duy trì quá trình thai nghén. Khi dùng trong chương trình kỹ thuật hỗ trợ sinh sản (ART) ở pha hoàng thể, progesteron hỗ trợ cho việc cấy phôi.

Dược động học

Hấp thu: Khi dùng đường uống, progesteron có sinh khả dụng rất thấp do bị chuyển hóa mạnh qua gan lần đầu. Progesteron được hấp thu khi đặt trực tràng hoặc âm đạo và hấp thu nhanh khi tiêm bắp ở dạng dung dịch dầu.

Phân bố: Progesteron liên kết nhiều với protein huyết tương. Khoảng 96 - 99% progesteron gắn với các protein huyết tương, chủ yếu với albumin (50 - 54%) và globulin gắn cortisoltranscortin (43 - 48%). Progesteron cũng được phân bố vào trong sữa mẹ.

Chuyển hóa: Progesteron được chuyển hóa chủ yếu ở gan thành các chất chuyển hóa khác nhau, trong đó phần lớn thành các pregnanediol và pregnanolon.

Thải trừ: Progesteron được thải trừ chủ yếu qua nước tiểu dưới dạng liên hợp glucuronid và sulfat. Một phần thải trừ qua mật và qua phân. Các chất chuyển hóa của progesteron thải trừ vào mật có thể có chu kỳ gan - ruột. Thuốc có nửa đời thải trừ ngắn khoảng vài phút.

Chỉ định

Vô kinh, vô kinh thứ phát.

Dự phòng tăng sản niêm mạc tử cung ở phụ nữ sau mãn kinh đang dùng liệu pháp thay thế hormon có estrogen.

Chảy máu tử cung bất thường do mất cân bằng hormon (ở người không có bệnh lý thực thể như u xơ tử cung hoặc ung thư tử cung).

Hỗ trợ khi cấy phôi và trong giai đoạn sớm của thai kỳ trong kỹ thuật hỗ trợ sinh sản ở phụ nữ vô sinh bị thiếu hụt progesteron.

Chống chỉ định

Mẫn cảm với thuốc.

Tiền sử hoặc đang có huyết khối thuyên tắc tĩnh mạch (huyết khối tĩnh mạch sâu, thuyên tắc phổi).

Tiền sử hoặc đang có thuyên tắc huyết khối động mạch (như đột quỵ, nhồi máu cơ tim).

Xuất huyết âm đạo bất thường không rõ nguyên nhân.

Xuất huyết não.

Bệnh gan hoặc rối loạn chức năng gan.

Đã biết hoặc nghi ngờ ung thư vú.

Thai chết lưu, sảy thai không hoàn toàn (dạng tiêm, gel đặt âm đạo, viên đặt âm đạo).

Chứa ngoài tử cung (dạng đặt âm đạo).

Ung thư các cơ quan sinh dục (dạng tiêm, gel đặt âm đạo).

Bệnh porphyrin cấp.

Mang thai hoặc nghi ngờ có thai (dạng uống).

Thận trọng

Trước khi bắt đầu điều trị bằng progesteron, phải khám vú và các cơ quan trong khung chậu, làm test Papanicolaou (test PAP, phết tế bào cổ tử cung).

Thận trọng khi dùng thuốc cho người bệnh có tiền sử trầm cảm, đái tháo đường, tăng lipid huyết hoặc các bệnh nặng lên do giữ nước (ví dụ: động kinh, đau nửa đầu, hen phế quản, rối loạn chức năng tim hoặc thận) do thuốc gây giữ nước.

Thận trọng khi sử dụng thuốc trên các bệnh nhân có các yếu tố nguy cơ các bệnh động mạch (như tăng huyết áp, đái tháo đường, hút thuốc lá, tăng cholesterol huyết, béo phì), tiền sử hoặc tiền sử gia đình có huyết khối thuyên tắc mạch, lupus ban đỏ hệ thống. Thuốc làm tăng nguy cơ thuyên tắc phổi, huyết khối tĩnh mạch sâu, đột quỵ và nhồi máu cơ tim.

Cần cảnh báo về những dấu hiệu và các triệu chứng sớm nhất của nhồi máu cơ tim, rối loạn mạch não, tình trạng nghẽn mạch huyết khối (như huyết khối tĩnh mạch sâu, thuyên tắc phổi), viêm tĩnh mạch huyết khối hoặc huyết khối võng mạc. Phải ngừng thuốc ngay lập tức khi nghi ngờ hoặc có bất kỳ rối loạn nào trong số các rối loạn trên xảy ra.

Dùng progestin phối hợp với estrogen có thể làm tăng nguy cơ ung thư vú, sa sút trí tuệ, nhồi máu cơ tim, đột quỵ, nghẽn mạch phổi, huyết khối tĩnh mạch sâu ở phụ nữ sau mãn kinh. Nên dùng progestin phối hợp với estrogen ít nhất 4 - 6 tuần trước khi tiến hành các phẫu thuật có tăng nguy cơ nghẽn mạch huyết khối hoặc trong giai đoạn bất động kéo dài. Dùng progestin phối hợp với estrogen trong thời gian ngắn nhất có thể được, phù hợp với đích điều trị. Định kỳ tiến hành đánh giá nguy cơ/lợi ích khi dùng thuốc. Nếu có hiện tượng mất hoặc giảm thị lực xảy ra đột ngột hay từ từ, không thể giải thích được, lồi mắt, song thị, phù gai thị, tổn thương mạch máu võng mạc hoặc đau nửa đầu, phải ngừng progesteron và tiến hành ngay các phương pháp chẩn đoán và điều trị.

Nếu có chảy máu âm đạo bất thường khi đang điều trị bằng progesteron, phải thăm khám đầy đủ để tìm nguyên nhân.

Thường xuyên kiểm tra huyết áp, test PAP, khám vú, chụp X-quang vú. Trong tất cả các trường hợp chảy máu âm đạo bất thường không rõ nguyên nhân, để chẩn đoán được đầy đủ, nên lấy mẫu niêm mạc tử cung để loại trừ khả năng ác tính.

Thời kỳ mang thai

Progesteron là hormon tự nhiên, được dùng để hỗ trợ khi cấy phôi và duy trì thai nghén trong kỹ thuật hỗ trợ sinh sản (ART) ở phụ nữ vô sinh, làm tăng tỷ lệ mang thai.

Có tăng nguy cơ khuyết tật nhỏ khi sinh ở những trẻ mà mẹ dùng progesteron trong 4 tháng đầu thai kỳ. Đã có báo cáo về tật lỗ tiểu

thấp ở trẻ nam, nam hóa nhẹ cơ quan sinh dục ngoài ở trẻ nữ khi bị phơi nhiễm trong 3 tháng đầu thai kỳ. Sút môi, hở vòm miệng, bệnh tim bẩm sinh, còn ống động mạch, khuyết tật vách tâm thất, chết trong tử cung và sảy thai tự nhiên đã được báo cáo trong một số trường hợp sau khi mẹ uống progesteron trong thời kỳ mang thai. Liều cao progesteron có thể làm giảm khả năng sinh sản. Cần có thêm các nghiên cứu đánh giá việc dùng progesteron để làm giảm nguy cơ sinh non. Dạng nang uống progesteron không được dùng trong thời kỳ mang thai.

Thời kỳ cho con bú

Progesteron được bài tiết vào sữa mẹ. Tránh sử dụng thuốc cho phụ nữ đang cho con bú.

Tác dụng không mong muốn (ADR)

Tiêm bắp

Tim mạch: phù não, nghẽn mạch não, phù.

TKTW: trầm cảm, sốt, mất ngủ, ngủ gà.

Da: trứng cá, ban dị ứng (hiếm), rụng tóc, chứng rụng lông ở phụ nữ, ngứa, mày đay.

Nội tiết và chuyển hóa: mất kinh, chảy máu giữa các kỳ kinh, nhạy cảm đau ở vú, tăng tiết sữa, rối loạn kinh nguyệt, đốm da.

Tiêu hóa: buồn nôn.

Tiết niệu - sinh dục: trở xước cổ tử cung, thay đổi bài tiết ở cổ tử cung.

Gan: vàng da ứ mật.

Tại vị trí tiêm: kích ứng, sưng, đau, đỏ.

Mắt: viêm dây thần kinh mắt, huyết khối võng mạc.

Hô hấp: nghẽn mạch phổi.

Khác: phản ứng phản vệ, tăng hoặc giảm thể trọng.

Liều cao (50 - 100 mg/ngày) có thể gây tác dụng dị hóa vừa phải và tăng bài tiết tạm thời natri và clorid.

Dạng uống

Phần trăm báo cáo khi dùng phối hợp với estrogen:

ADR > 10%

TKTW: đau đầu (10 - 31%), hoa mắt chóng mặt (15 - 24%), trầm cảm (19%).

Nội tiết và chuyển hóa: nhạy cảm đau ở vú (27%), đau vú (6 - 16%).

Tiêu hóa: đau bụng (6 - 12%), trướng bụng (10 - 20%).

Tiết niệu - sinh dục: các vấn đề ở đường tiết niệu (11%).

Thần kinh cơ và xương: đau khớp (20%), đau cơ xương (6 - 12%).

Khác: nhiễm virus (7 - 12%).

ADR từ 5 - 10%

Tim mạch: đau ngực (7%).

TKTW: mệt mỏi (8 - 9%), dễ xúc động (6%), dễ bị kích thích (5 - 8%), lo lắng (8%).

Tiêu hóa: buồn nôn/nôn (8%), tiêu chảy (8%).

Hô hấp: nhiễm trùng đường hô hấp trên (5%), ho (8%).

Khác: ra mồ hôi đêm (7%).

ADR < 5% (giới hạn những ADR quan trọng hoặc đe dọa tính mạng)

Tim mạch: tăng huyết áp, hạ huyết áp, nhịp tim nhanh, đau thắt ngực, suy tuần hoàn, ngất, phù mắt, phù, thiếu máu thoáng qua (TIA).

TKTW: mất ngủ, hồi hộp, lo âu, giảm/mất ý thức, rối loạn nhân cách, mất định hướng, lú lẫn, an thần, ngủ gà, rối loạn lời nói, trạng thái thờ ơ, ý nghĩ tự tử, co giật.

Da: trứng cá, rụng tóc, ngứa, mày đay, dị cảm, mụn cóc.

Nội tiết và chuyển hóa: tăng glucose huyết, thay đổi nồng độ lipid trong huyết thanh, chứng vú to ở nam, các triệu chứng giống hội chứng trước kỳ kinh nguyệt, thay đổi chu kỳ kinh, chảy máu kinh nguyệt không đều.

Tiết niệu - sinh dục: khô âm đạo, viêm âm đạo, nhiều khí hư, viêm âm đạo do nấm, ung thư vú, u nang buồng trứng, u xơ tử cung, ung

thư nội mạc tử cung.

Tiêu hóa: khô miệng, sưng lưỡi, khó tiêu, khó nuốt, táo bón, viêm dạ dày - ruột, xuất huyết trực tràng.

Gan: tăng ALT, tăng AST, tăng GGT, ứ mật, vàng da, viêm gan ứ mật, suy gan, hoại tử gan.

Tụy: viêm tụy cấp.

Mắt: nhìn mờ, song thị, rối loạn thị giác.

Tai: ù tai.

Cơ - xương - khớp: đau khớp, viêm khớp, chuột rút.

Toàn thân: phản ứng quá mẫn, phản ứng phản vệ, bệnh hạch bạch huyết, mệt mỏi, đi lại khó khăn.

Gel dùng trong âm đạo

Phần trăm báo cáo khi dùng trong kỹ thuật hỗ trợ sinh sản:

ADR > 10%

TKTW: ngủ gà (27%), đau đầu (13 - 17%), kích động (16%), trầm cảm (11%).

Nội tiết và chuyển hóa: nở vú (40%), đau vú (13%), giảm tình dục (11%).

Tiêu hóa: táo bón (27%), buồn nôn (7 - 22%), co cứng cơ (15%), đau bụng (12%).

Tiết niệu - sinh dục: đau đáy chậu (17%), tiểu tiện đêm (13%).

ADR từ 5 - 10%

TKTW: đau (8%), hoa mắt chóng mặt (5%).

Tiêu hóa: tiêu chảy (8%), trướng bụng (7%), nôn (5%).

Tiết niệu - sinh dục: tăng dịch âm đạo (7%), giao hợp đau (6%), bệnh do *Monilia* đường sinh dục (5%), ngứa sinh dục (5%).

Thần kinh cơ và xương: đau khớp (8%).

Viên đặt âm đạo

Phần trăm báo cáo khi dùng trong kỹ thuật hỗ trợ sinh sản:

ADR > 10%

Tiêu hóa: đau bụng (12%).

Khác: đau sau khi lấy trứng (25 - 28%).

ADR từ 1 - 10%

TKTW: đau đầu (3 - 4%), mệt mỏi (2 - 3%).

Nội tiết và chuyển hóa: hội chứng quá kích buồng trứng (7%).

Tiêu hóa: buồn nôn (7 - 8%), nôn (2 - 3%), trướng bụng (4%), táo bón (2 - 3%).

Tiết niệu - sinh dục: co thắt tử cung (3 - 4%), chảy máu âm đạo (3%), nhiễm trùng đường tiết niệu (1 - 2%).

ADR < 1%

Nóng, khó chịu, ngứa, mày đay, phù ngoại biên, kích ứng âm đạo.

Hướng dẫn cách xử trí ADR

Trước và trong quá trình điều trị phải định kỳ kiểm tra huyết áp, test PAP, khám vú, chụp X-quang vú. Nếu xuất hiện chảy máu âm đạo bất thường không rõ nguyên nhân, cần ngừng thuốc, tiến hành ngay các phương pháp chẩn đoán và điều trị phù hợp.

Phải ngừng thuốc ngay khi nghi ngờ hoặc có bất kỳ rối loạn nào về nhồi máu cơ tim, rối loạn mạch não, tình trạng nghẽn mạch huyết khối (như nghẽn mạch huyết khối tĩnh mạch, nghẽn mạch phổi), viêm tĩnh mạch huyết khối hoặc huyết khối võng mạc.

Phải ngừng progesteron và tiến hành ngay các phương pháp chẩn đoán và điều trị thích hợp nếu có bất thường về thị giác hoặc đau nửa đầu hoặc trầm cảm tái phát ở mức độ nặng.

Liều lượng và cách dùng

Cách dùng

Progesteron dùng đường uống, dùng trong âm đạo và tiêm bắp sâu. Các chế phẩm chứa progesteron dạng vi hạt cũng được dùng để uống và dùng trong âm đạo.

Nang progesteron uống mỗi ngày một lần lúc đi ngủ (để có thể giảm nhẹ một số ADR của thuốc như hoa mắt chóng mặt, rối loạn thị giác). Dạng gel progesteron dùng trong âm đạo không được dùng đồng thời với các chế phẩm dùng trong âm đạo khác. Nếu cần thiết phải điều trị cùng với các thuốc khác cũng dùng đường âm đạo, phải dùng các thuốc này cách nhau 6 giờ.

Không nên dùng đồng thời viên đặt âm đạo progesteron với các chế phẩm dùng trong âm đạo khác, vì có thể làm thay đổi sự giải phóng và hấp thu progesteron từ viên đặt âm đạo.

Liều lượng (ở người lớn)

Vô kinh: Tiêm bắp 5 - 10 mg/ngày, trong 6 - 8 ngày liên tiếp. Khi hoạt động của buồng trứng đủ làm tăng sinh nội mạc tử cung, chảy máu kinh nguyệt thường sẽ xảy ra sau 48 - 72 giờ ngừng thuốc. Chỉ sau một đợt điều trị, một số phụ nữ đã có chu kỳ kinh nguyệt tự phát bình thường.

Vô kinh thứ phát:

Viên nang uống: Uống mỗi ngày một lần 400 mg vào buổi tối trong 10 ngày.

Gel dùng trong âm đạo: Mỗi lần dùng 45 mg progesteron (gel 4%) đưa vào trong âm đạo, cách một ngày dùng một lần, tổng cộng 6 liều. Những phụ nữ không đáp ứng với gel 4% có thể dùng gel 8%, mỗi lần 90 mg progesteron, đưa vào trong âm đạo, cách một ngày dùng một lần, tổng cộng 6 liều.

Chảy máu tử cung bất thường do mất cân bằng hormon: Tiêm bắp 5 - 10 mg/ngày, trong 6 ngày. Nếu phối hợp với estrogen thì sau 2 tuần dùng estrogen mới bắt đầu dùng progesteron. Trong khi điều trị với progesteron, nếu kinh nguyệt xảy ra thì ngừng thuốc.

Dự phòng tăng sản niêm mạc tử cung ở phụ nữ sau mãn kinh đang dùng liệu pháp thay thế hormon có estrogen: Uống mỗi ngày một lần 200 mg vào buổi tối trong 12 ngày liên tiếp của chu kỳ 28 ngày (ví dụ uống từ ngày 17 đến ngày 28).

Trong kỹ thuật hỗ trợ sinh sản (ART) ở phụ nữ vô sinh bị thiếu hụt progesteron:

Gel dùng trong âm đạo: Mỗi lần dùng 90 mg progesteron (gel 8%) đưa vào trong âm đạo, mỗi ngày một lần. Nếu có thai, có thể tiếp tục điều trị tới 10 - 12 tuần. Hoặc mỗi lần 100 mg (dạng viên đặt âm đạo), ngày 2 - 3 lần, bắt đầu lúc lấy noãn và tiếp tục tới 10 tuần.

Trong kỹ thuật hỗ trợ sinh sản (ART) ở phụ nữ bị suy buồng trứng hoàn toàn hoặc một phần, mỗi lần dùng 90 mg progesteron (gel 8%), ngày 2 lần. Nếu có thai, có thể tiếp tục điều trị tới 12 tuần.

Bệnh nhân suy thận: Không cần hiệu chỉnh liều trên bệnh nhân suy thận.

Bệnh nhân suy gan: Chống chỉ định dùng thuốc trên bệnh nhân suy giảm chức năng gan.

Tương tác thuốc

Tránh dùng đồng thời: Dabigatran etexilat, rivaroxaban, silodosin, toptecan.

Tăng tác dụng/độc tính: Ketoconazol ức chế mạnh CYP3A4, giảm chuyển hóa và tăng tác dụng của progesteron.

Các progesteron có thể ức chế chuyển hóa của cyclosporin dẫn đến tăng nồng độ của cyclosporin trong huyết tương và có nguy cơ nhiễm độc cyclosporin.

Các progesteron ảnh hưởng đến tác dụng của bromocriptin.

Giảm tác dụng: Các chất gây cảm ứng mạnh CYP3A4 (carbamazepin, griseofulvin, phenobarbital, phenytoin, rifampicin) có thể làm tăng độ thanh thải của progesteron và giảm tác dụng của progesteron.

Phối hợp progestin với estrogen có thể gây sai lệch kết quả các test đánh giá chức năng tuyến giáp, chức năng gan, đông máu, chức năng nội tiết và test metyrapon. Sự phối hợp này cũng làm giảm bài tiết pregnanediol.

Cập nhật lần cuối: 2018.

PROGUANIL

Tên chung quốc tế: Proguanil.

Mã ATC: P01BB01.

Loại thuốc: Thuốc chống sốt rét.

Dạng thuốc và hàm lượng

Viên nén 100 mg (Proguanil hydroclorid).

Viên nén kết hợp 100 mg proguanil hydroclorid và 250 mg atovaquon.

Dược lực học

Proguanil là một dẫn chất biguanid có hoạt tính chống sốt rét thấp, thuốc chỉ tác dụng khi bị chuyển hóa trong cơ thể thành cycloguanil. Cycloguanil ức chế enzym dihydrofolat-reductase của ký sinh trùng sốt rét vì vậy làm giảm tổng hợp acid folic là một yếu tố cần thiết cho sự tổng hợp acid nucleic và protein của ký sinh trùng. Cycloguanil có tác dụng chống lại thể tiền hồng cầu và hoạt tính diệt thể phân liệt trong máu chậm khi sử dụng một mình, nên thích hợp cho phòng bệnh. Thuốc cũng có một số tác dụng diệt bào tử làm các giao tử bào không lây nhiễm đối với muỗi truyền bệnh nên chặn được bệnh sốt rét lan truyền.

Giá trị của proguanil bị hạn chế do kháng thuốc phát triển nhanh.

Proguanil được dùng theo đường uống dưới dạng muối hydroclorid để phòng và điều trị sốt rét cùng với cloroquin hoặc atovaquon. Nếu dùng proguanil hoặc cycloguanil đơn độc thì tác dụng diệt thể phân liệt trên các thể hồng cầu quá chậm, nên thường phối hợp với atovaquon để điều trị sốt rét không biến chứng do *P. falciparum*.

Kháng chéo một phần cũng xảy ra với các thuốc kháng folat khác, đặc biệt là với pyrimethamin.

Dược động học

Thuốc được hấp thu nhanh từ đường tiêu hóa, nhưng còn chưa biết rõ sinh khả dụng tuyệt đối. Sau khi uống một lần 200 mg proguanil hydroclorid, nồng độ đỉnh trong huyết tương đạt được 150 - 200 nanogam/ml sau 2 - 4 giờ. Nồng độ tương đương của các chất chuyển hóa có hoạt tính cycloguanil là 24% và chất 4 - clorophenylbiguanil không có hoạt tính (CPB) là 6% so với chất mẹ. Nồng độ đỉnh trong huyết tương của cycloguanil đạt tối đa 50 nanogam/ml sau khoảng 6 giờ uống proguanil.

Nồng độ proguanil trong huyết tương bằng khoảng 20% nồng độ trong máu toàn phần vì proguanil tập trung nhiều hơn vào hồng cầu, còn nồng độ cycloguanil là chất chuyển hóa có hoạt tính thì giống nhau ở cả hai môi trường. Nồng độ proguanil và các chất chuyển hóa trong huyết tương và trong máu toàn phần giảm song song với nhau, với nửa đời thải trừ ở pha cuối khoảng 16 giờ. Proguanil liên kết với protein huyết tương khoảng 75%.

Proguanil được chuyển hóa ở gan thành cycloguanil nhờ isoenzym của cytochrom P450. Khả năng chuyển hóa này thay đổi rất lớn tùy theo cá thể. Số người chuyển hóa proguanil chậm ở các chủng tộc người da trắng (khoảng 3%) thấp hơn so với số người chuyển hóa chậm ở châu Á (20%) và ở châu Phi (ở Kenya 35%). Ở những người chuyển hóa chậm, sự khác biệt chuyển hóa này có thể có ý nghĩa lâm sàng. Dự phòng sốt rét bằng proguanil có thể không hiệu lực ở những người này vì họ không đạt được nồng độ điều trị đầy đủ của cycloguanil, ngay cả khi dùng nhiều liều. Tuy vậy cho tới nay chưa có nghiên cứu đầy đủ nào khẳng định vấn đề này.

Nửa đời thải trừ của proguanil và cycloguanil khoảng 20 giờ. Khoảng 40 - 60% proguanil đào thải qua nước tiểu, trong đó 60% là dạng không biến đổi và 30% là dạng chuyển hóa cycloguanil, phần còn lại thải trừ qua phân. Thể tích phân bố 15,4 - 49,3 lít/kg. Dược động học của thuốc ở trẻ em vẫn còn chưa biết rõ.