

nửa liều sulfasalazin hàng ngày, sau đó tăng dần liều trong vài ngày. Nếu không dung nạp dạ dày tiếp tục xảy ra, nên ngừng thuốc trong 5 - 7 ngày, sau đó dùng lại với liều hàng ngày thấp hơn.

#### Liều dùng

Người lớn:

*Điều trị đợt cấp viêm loét đại trực tràng nhẹ, vừa và nặng/bệnh Crohn thể hoạt động:*

Uống: Điều trị đợt cấp, uống 1 - 2 g/lần, 4 lần/ngày cho đến khi thuyên giảm (kết hợp dùng corticoid nếu cần thiết). Tuy nhiên, liều trên 4 g/ngày, sẽ làm tăng nguy cơ độc tính, nên ở Mỹ, liều được khuyến cáo theo cách khác là uống 1 g/lần, 3 - 4 lần/ngày. Khoảng cách giữa các liều qua đêm không quá 8 giờ. Dùng viên bao tan trong ruột cũng được khuyến cáo để giảm ADR đường tiêu hóa.

Đặt trực tràng: Dùng riêng hoặc kết hợp với đường uống, 0,5 - 1 g/lần, 2 lần/ngày, dùng vào buổi sáng và tối sau khi đi đại tiện.

Điều trị duy trì viêm loét đại trực tràng nhẹ, vừa và nặng:

Uống: 500 mg/lần, 4 lần/ngày.

Đặt trực tràng: Dùng riêng hoặc kết hợp với đường uống, 0,5 - 1 g/lần, 2 lần/ngày, dùng vào buổi sáng và tối sau khi đi đại tiện.

*Viêm khớp dạng thấp:*

Dùng viên bao tan trong ruột, liều 500 mg/ngày, uống trong tuần thứ nhất, sau đó tăng mỗi tuần thêm 500 mg, đến liều tối đa 2 - 3 g/ngày, chia làm 2 - 4 lần uống, tùy theo dung nạp thuốc và đáp ứng. Trẻ em:

*Điều trị đợt cấp viêm loét đại trực tràng nhẹ, vừa và nặng/bệnh Crohn thể hoạt động:*

Đường uống: Trẻ em 2 - 11 tuổi: 10 - 15 mg/kg/lần (tối đa 1 g/lần), 4 - 6 lần/ngày, uống đến khi bệnh thuyên giảm; nếu cần, tăng tối đa 60 mg/kg/ngày, chia làm nhiều lần uống. 12 - 17 tuổi: Uống 1 - 2 g/lần, 4 lần/ngày, uống đến khi bệnh thuyên giảm.

Đặt trực tràng: Trẻ em 5 - 7 tuổi, 500 mg/lần, 2 lần/ngày; 8 - 11 tuổi: 500 mg vào buổi sáng và 1 g vào buổi tối; 12 - 17 tuổi: 0,5 - 1 g/lần, 2 lần/ngày.

Điều trị duy trì viêm loét đại trực tràng nhẹ, vừa và nặng:

Đường uống: Trẻ em 2 - 11 tuổi: 5 - 7,5 mg/kg/lần (tối đa 500 mg/lần), 4 lần/ngày; 12 - 17 tuổi: 500 mg/lần, 4 lần/ngày.

Đặt trực tràng: Trẻ em 5 - 7 tuổi, 500 mg/lần, 2 lần/ngày; 8 - 11 tuổi: 500 mg vào buổi sáng và 1 g vào buổi tối; 12 - 17 tuổi: 0,5 - 1 g/lần, 2 lần/ngày.

*Viêm đa khớp dạng thấp thiếu niên (viêm khớp vô căn thiếu niên):*

Trẻ em  $\geq 6$  tuổi: Uống viên bao tan trong ruột 30 - 50 mg/kg/ngày, chia làm 2 lần, cho tới tối đa 2 g/ngày. Liều đầu tiên phải bằng 1/4 - 1/3 liều duy trì dự kiến, sau đó hàng tuần tăng liều cho tới liều duy trì sau 1 tháng.

Ghi chú: Ở Anh không khuyến cáo dùng.

*Người suy thận:* Không cần điều chỉnh liều, dùng thận trọng. Suy thận nặng không dùng.

*Người suy gan:* Không cần điều chỉnh liều, dùng thận trọng. Suy gan nặng không dùng.

#### Tương tác thuốc

Digoxin: Sinh khả dụng của digoxin bị giảm khi uống đồng thời với sulfasalazin.

Acid folic: Sulfasalazin ức chế sự hấp thu, ngăn cản chuyển hóa của acid folic nên có thể dẫn đến giảm nồng độ acid folic trong huyết thanh. Khi điều trị với sulfasalazin, cần bổ sung acid folic.

Sắt: Sulfasalazin tạo chelat với sắt, làm thay đổi hấp thu và phân bố của sulfasalazin, làm giảm nồng độ sulfasalazin trong máu.

Các thuốc chống đông, chống co giật, thuốc uống chống đái tháo đường có thể bị đẩy ra khỏi vị trí gắn protein và/hoặc chuyển hóa của các thuốc này có thể bị ức chế bởi các sulfonamid, dẫn đến tăng hoặc kéo dài tác dụng hoặc độc tính. Cần phải điều chỉnh liều trong

và sau khi điều trị bằng sulfasalazin.

Dùng đồng thời với các thuốc gây tan máu có thể làm tăng khả năng gây độc của thuốc.

Sulfasalazin có thể làm tăng nồng độ/tác dụng của: heparin (trọng lượng phân tử thấp), methotrexat, prilocain, natri nitrit, các thuốc tương tự thiopurin (thiopurin analog), vắc xin có chứa virus *Varicella*, phenylbutazon, sulfipyrazon.

Nồng độ/tác dụng của sulfasalazin có thể tăng bởi các thuốc: dapson (dùng ngoài), nitric oxid, NSAID.

Sulfasalazin có thể bị giảm nồng độ/tác dụng bởi: glycosid tim, methylfolat.

#### Quá liều và xử trí

*Triệu chứng:* buồn ngủ, chóng mặt, chán ăn, đau bụng, buồn nôn, nôn, sốt, thiếu máu tan huyết.

*Xử trí:* Không có thuốc giải độc đặc hiệu. Ngừng dùng thuốc ngay khi có phản ứng quá mẫn xảy ra. Có thể cho dùng thuốc kháng histamin hoặc corticoid để hạn chế dị ứng.

Rửa dạ dày, gây nôn, hoặc cho dùng thuốc tẩy khi cần. Kiểm hóa nước tiểu. Thúc đẩy lợi niệu nếu chức năng thận bình thường.

*Cập nhật lần cuối:* 2019.

## SULPIRID

**Tên chung quốc tế:** Sulpiride.

**Mã ATC:** N05AL01.

**Loại thuốc:** Thuốc chống loạn thần.

#### Dạng thuốc và hàm lượng

Viên nén: 50 mg, 200 mg, 400 mg.

Viên nang: 50 mg.

Dung dịch uống: 200 mg/5 ml.

#### Dược lực học

Sulpirid thuộc nhóm benzamid, có tác dụng chống rối loạn tâm thần và chống trầm cảm thông qua ức chế chọn lọc các thụ thể dopamin  $D_2$  ở não. Có thể coi sulpirid như một thuốc trung gian giữa các thuốc an thần kinh (neuroleptic) và thuốc chống trầm cảm, vì sulpirid có cả hai tác dụng đó. Trái với đa số các thuốc an thần kinh khác ức chế cả hai loại thụ thể dopamin  $D_1$  và  $D_2$ , sulpirid có tác dụng chọn lọc hơn trên thụ thể dopamin  $D_2$ . Tuy nhiên, tác dụng ức chế chọn lọc của sulpirid không làm giảm nhiều tác dụng phụ ngoại tháp cũng như các tác dụng phụ khác của các thuốc chống loạn thần. Sulpirid không có tác dụng trên các thụ thể norepinephrin, acetylcholin, serotonin, histamin hoặc acid gamma aminobutyric (GABA).

Thuốc có tác dụng trên triệu chứng âm tính và dương tính của bệnh tâm thần phân liệt. Bên cạnh đó, thuốc có một số tác dụng khác như chống trầm cảm, kích thích bài tiết sữa, cải thiện lưu lượng máu và tiết niêm dịch ở niêm mạc dạ dày tá tràng. Tuy nhiên, các dữ liệu chưa đủ để đánh giá vai trò của sulpirid trong điều trị trầm cảm, thiếu sữa mẹ hay loét dạ dày tá tràng. Tất cả các nghiên cứu về sulpirid đều trên một số lượng nhỏ người bệnh chưa đủ để đánh giá hiệu quả và an toàn của thuốc.

#### Dược động học

*Hấp thu:* Sulpirid được hấp thu chậm từ đường tiêu hóa, thời gian thuốc đạt nồng độ đỉnh trong huyết tương từ 3 - 6 giờ. Sinh khả dụng đường uống từ 27 - 34%. Thức ăn làm giảm hấp thu của thuốc.

*Phân bố:* Sulpirid phân bố nhanh vào các mô nhưng thấm ít qua hàng rào máu - não. Thể tích phân bố: 1 - 2,7 lít/kg. Tỷ lệ liên kết với protein khoảng 40%. Sulpirid phân bố vào trong sữa mẹ và qua

nhau thai.

**Thải trừ:** 95% thuốc được thải trừ nguyên vẹn qua thận và phân. Nửa đời thải trừ của thuốc từ 8 - 9 giờ.

**Chỉ định**

Điều trị tâm thần phân liệt.

**Chống chỉ định**

Mẫn cảm với thuốc.

U tùy thượng thận.

Rối loạn chuyển hóa porphyrin cấp.

Trạng thái TKTW bị ức chế, hôn mê.

Tiền sử có khối u phụ thuộc prolactin.

**Thận trọng**

Thận trọng khi dùng sulpirid do thuốc có thể gây ra hội chứng an thần kinh ác tính. Trong khi điều trị, nếu thấy sốt cao không rõ nguyên nhân, phải ngừng thuốc ngay do sốt cao có thể là một biểu hiện của hội chứng an thần kinh ác tính.

Sulpirid kéo dài khoảng QT, tác dụng này phụ thuộc liều dùng. Tác dụng này làm tăng nguy cơ loạn nhịp tim nặng đặc biệt là xoắn đỉnh, nhất là khi có nhịp tim chậm < 55 nhịp/phút, giảm kali huyết, tiền sử khoảng QT kéo dài. Trước khi dùng sulpirid, nếu có thể, phải loại trừ các yếu tố kể trên, nên làm thêm điện tâm đồ.

Phải thận trọng khi dùng sulpirid cho người cao tuổi, đặc biệt khi bị sa sút trí tuệ, khi có các yếu tố nguy cơ tai biến mạch máu não vì dễ bị hạ huyết áp thể đứng, dễ ngã, buồn ngủ và tác dụng ngoại tháp. Nguy cơ tử vong thường tăng lên khi dùng các thuốc chống loạn thần ở độ tuổi này.

Người suy thận, cần giảm liều sulpirid và tăng cường theo dõi. Nếu suy thận nặng, nên cho điều trị từng đợt gián đoạn.

Cần tăng cường theo dõi các đối tượng sau:

Người bị động kinh vì có khả năng ngưỡng co giật bị hạ thấp.

Người uống rượu hoặc đang dùng các loại thuốc chứa rượu vì làm tăng tác dụng gây ức chế TKTW.

Sulpirid liều thấp có thể làm các triệu chứng nặng thêm ở người bị hung cảm nhẹ.

**Thời kỳ mang thai**

Thuốc qua được nhau thai. Tác dụng bất lợi ở trẻ sơ sinh phơi nhiễm với thuốc trong 3 tháng cuối thai kỳ được báo cáo như: nhịp tim nhanh, tăng kích thích, trướng bụng, chậm ra phân xu, tăng trương lực cơ, run, ngủ. Phải theo dõi trẻ sơ sinh để phát hiện các triệu chứng kể trên.

**Thời kỳ cho con bú**

Sulpirid phân bố vào sữa mẹ với lượng tương đối lớn và có thể gây tác dụng bất lợi đối với trẻ bú mẹ. Quyết định dùng thuốc phụ thuộc vào việc cân nhắc lợi ích cho mẹ và tác dụng bất lợi ở trẻ.

**Tác dụng không mong muốn (ADR)**

Sulpirid dung nạp tốt. Khi dùng liều điều trị, ADR thường nhẹ hơn các thuốc chống loạn thần khác.

**Thường gặp**

TKTW: mất ngủ hoặc buồn ngủ.

Nội tiết: tăng prolactin huyết, tăng tiết sữa, rối loạn kinh nguyệt hoặc vô kinh.

Tiêu hóa: táo bón, tăng enzym gan.

Da, mô dưới da: phát ban da sần.

**Ít gặp**

TKTW: kích thích quá mức, hội chứng ngoại tháp (ngồi không yên, vẹo cổ, cơn quay mắt), hội chứng Parkinson, loạn trương lực cơ cấp, tăng trương lực cơ.

Tim mạch: khoảng QT kéo dài (gây loạn nhịp, xoắn đỉnh), hạ huyết áp tư thế.

Máu và hệ tạo máu: giảm bạch cầu.

Tiêu hóa: tăng tiết nước bọt.

**Hiếm gặp**

Nội tiết: chứng vú to ở đàn ông, rối loạn cương dương, rối loạn cực khoái.

TKTW: loạn vận động muộn, hội chứng an thần kinh ác tính.

Tim mạch: rối loạn nhịp thất, rung thất, nhịp nhanh thất.

Khác: hạ thân nhiệt, nhạy cảm với ánh sáng, vàng da do ứ mật.

**Liều lượng và cách dùng**

**Cách dùng:** Thuốc được dùng đường uống.

**Liều dùng**

*Người lớn và trẻ em trên 14 tuổi:*

Triệu chứng âm tính của tâm thần phân liệt: Khởi đầu uống 200 - 400 mg/lần, ngày 2 lần. Điều chỉnh liều theo đáp ứng điều trị. Liều tối đa 800 mg/ngày.

Triệu chứng dương tính của tâm thần phân liệt: Khởi đầu uống 200 - 400 mg/lần, ngày 2 lần. Tăng liều theo đáp ứng điều trị. Liều tối đa 2,4 g/ngày.

Bệnh nhân có triệu chứng âm và dương tính kết hợp thường đáp ứng với liều 400 - 600 mg/lần, ngày uống 2 lần.

*Người cao tuổi:* Liều dùng cho người cao tuổi cũng giống như với người lớn, nhưng liều khởi đầu thấp hơn.

Khởi đầu 50 - 100 mg/lần, ngày 2 lần, sau tăng dần đến liều hiệu quả.

*Người suy thận:* Phải giảm liều dùng hoặc tăng khoảng cách giữa các lần dùng thuốc tùy thuộc chức năng thận.

Cl<sub>cr</sub> 30 - 60 ml/phút: Dùng liều bằng 2/3 liều người bình thường hoặc tăng khoảng đưa liều gấp 1,5 lần.

Cl<sub>cr</sub> 10 - 30 ml/phút: Dùng liều bằng 1/2 liều bình thường hoặc tăng khoảng đưa liều 2 lần.

Cl<sub>cr</sub> < 10 ml/phút: Dùng liều bằng 1/3 liều bình thường hoặc tăng khoảng đưa liều 3 lần.

**Tương tác thuốc**

Chống chỉ định phối hợp sulpirid với levodopa hoặc thuốc điều trị Parkinson (bao gồm cả ropinirol) do đối kháng tác dụng.

Thuốc chủ vận dopamin điều trị Parkinson như amantadin, apomorphin, bromocriptin, entacapon, lisurid, pergolid, piribedil, pramipexol, ropinirol, selegilin gây đối kháng tác dụng giữa dopamin và thuốc an thần kinh. Thuốc chủ vận dopamin có thể gây ra hoặc làm nặng thêm các rối loạn tâm thần. Trong trường hợp cần thiết phải sử dụng thuốc an thần kinh cho bệnh nhân Parkinson đang điều trị bằng thuốc chủ vận dopamin, phải giảm dần liều thuốc chủ vận dopamin cho tới khi ngừng hẳn (nếu ngừng thuốc này đột ngột, có nguy cơ xảy ra hội chứng ác tính do thuốc an thần kinh).

**Thuốc an thần:** Các dẫn chất của morphin (giảm đau, chống ho, thay thế), thuốc an thần kinh, barbiturat, benzodiazepin, thuốc giải lo âu ngoài benzodiazepin như meprobamat, thuốc gây ngủ, thuốc chống trầm cảm (amitriptylin, doxepin, mianserin, mirtazapin, trimipramin), thuốc kháng histamin H<sub>1</sub> gây ngủ, baclofen, thalidomid khi phối hợp làm tăng tác dụng ức chế hệ TKTW, làm giảm tính tỉnh táo và hạ huyết áp.

**Thuốc có khả năng gây xoắn đỉnh:** thuốc chẹn beta, thuốc chẹn kênh calci (diltiazem, verapamil), thuốc chống loạn nhịp nhóm I<sub>a</sub> (quinin, hydroquinidin, disopyramid) và nhóm III (amiodaron, sotalol, dofetilid, ibutilid) và các thuốc khác như pimozid, haloperidol, methadon, thuốc chống trầm cảm imipramin, lithi, cisaprid, thioridazin, erythromycin đường tĩnh mạch, halofantrin, pentamidin: Có nguy cơ làm tăng rối loạn nhịp tim, đặc biệt xoắn đỉnh.

Sucralfat hoặc các thuốc kháng acid có chứa nhôm hoặc magnesi hydroxyd làm giảm hấp thu sulpirid. Vì vậy, nên dùng sulpirid trước khi uống các thuốc kháng acid 2 giờ để tránh tương tác.

**Lithi:** Làm tăng nguy cơ gây rối loạn ngoại tháp của sulpirid. Ngừng phối hợp khi bệnh nhân có dấu hiệu nhiễm độc thần kinh.

**Rượu:** Làm tăng tác dụng gây ngủ của thuốc, vì vậy tránh uống rượu và các thức uống có cồn trong khi dùng sulpirid.

Thuốc chẹn beta trong suy tim (bisoprolol, carvedilol, metoprolol, nebivolol): Tăng nguy cơ rối loạn nhịp thất, đặc biệt xoắn đỉnh. Cần theo dõi lâm sàng, điện tâm đồ.

Thuốc làm giảm kali huyết: Thuốc lợi tiểu giảm kali huyết, thuốc nhuận tràng kích thích, glucocorticoid, tetracosactid, amphotericin tiêm tĩnh mạch: Tăng nguy cơ rối loạn nhịp thất, đặc biệt xoắn đỉnh. Cần điều trị giảm kali huyết trước khi cho dùng sulpirid, theo dõi lâm sàng, điện tâm đồ và điện giải đồ.

#### Quá liều và xử trí

**Triệu chứng:** Các biểu hiện lâm sàng của ngộ độc khác nhau tùy thuộc liều. Sau khi dùng liều 1 - 3 g, cảm giác bồn chồn và trạng thái mất tập trung đã được báo cáo và (hiếm khi) có các triệu chứng ngoại tháp. Liều từ 3 - 7 g có thể gây kích động, lú lẫn và các triệu chứng ngoại tháp; liều cao hơn 7 g có thể gây hôn mê và huyết áp thấp.

Nhiễm độc thường xảy ra trong thời gian ngắn, các triệu chứng sẽ biến mất trong vài giờ. Tình trạng hôn mê xảy ra sau khi dùng thuốc liều cao có thể kéo dài đến 4 ngày.

**Xử trí:** Không có thuốc giải độc đặc hiệu. Sulpirid có thể loại bỏ một phần bằng lọc máu.

Điều trị triệu chứng. Hồi sức hô hấp tim mạch, theo dõi liên tục cho tới khi hồi phục (nguy cơ QT kéo dài và loạn nhịp thất). Nếu xuất hiện hội chứng ngoại tháp nặng, có thể dùng một thuốc kháng cholinergic.

Quá liều có thể được điều trị bằng kiểm hóa nước tiểu và thuốc điều trị Parkinson nếu cần. Thuốc gây nôn không có hiệu quả khi quá liều sulpirid.

Cập nhật lần cuối: 2020.

## SUMATRIPTAN

**Tên chung quốc tế:** Sumatriptan.

**Mã ATC:** N02CC01.

**Loại thuốc:** Thuốc chủ vận chọn lọc trên thụ thể 5-HT<sub>1</sub>, chống đau nửa đầu (migrain).

#### Dạng thuốc và hàm lượng

*Dưới dạng sumatriptan:*

Dung dịch xịt mũi: 5 mg/0,1 ml; 10 mg/0,1 ml; 20 mg/0,1 ml.

*Dưới dạng sumatriptan succinat (hàm lượng được biểu thị theo sumatriptan base):*

Viên nén: 25 mg, 50 mg, 100 mg.

Dung dịch tiêm dưới da: Ống tiêm 4 mg/0,5ml; 6 mg/0,5ml.

#### Dược lực học

Tuần hoàn động mạch cảnh cung cấp máu đến các mô ngoài và trong sọ não như màng não. Mặc dù nguyên nhân cho cơn đau nửa đầu chưa được hiểu rõ hoàn toàn, người ta cho rằng giãn/phù các mạch máu này và viêm dây thần kinh sinh ba do giải phóng các peptid hoạt mạch tại chỗ như serotonin (5-hydroxytryptamin, 5-HT) và CGRP (Calcitonin gene-related protein) tham gia vào cơ chế của bệnh. Serotonin đóng vai trò quan trọng trong cơ chế bệnh sinh của bệnh đau nửa đầu. Nồng độ serotonin giảm nhanh trong cơn đau, thêm vào đó sự tăng rõ rệt chất chuyển hóa chính của serotonin 5-HIAA (5-hydroxyindoleacetic acid) trong nước tiểu trên bệnh nhân đau nửa đầu cho thấy sự thoái giáng nhanh chóng serotonin trong cơn đau. Truyền tĩnh mạch serotonin có thể làm giảm cơn đau nửa đầu. Tuy nhiên, do ADR, việc sử dụng serotonin

trên lâm sàng bị loại trừ. Sumatriptan là một chất chủ vận chọn lọc trên các thụ thể 5-HT<sub>1D</sub> của mạch máu sọ não. Sumatriptan gắn với các thụ thể 5-HT<sub>1</sub>, ức chế hoạt động của adenylat cyclase, tăng nồng độ calci nội bào và ảnh hưởng đến các hoạt động nội bào khác dẫn đến co mạch và ức chế dẫn truyền cảm giác đau trên dây thần kinh sinh ba. Hai tác dụng này (co mạch sọ não và ức chế hoạt tính của dây thần kinh sinh ba) có thể góp phần vào tác dụng điều trị cơn đau nửa đầu của sumatriptan ở người. Sumatriptan có ái lực yếu trên 5-HT<sub>1A</sub> và không có ái lực trên các receptor serotonin khác, do vậy ít ADR hơn ergotamin và dihydroergotamin. Thuốc không có ái lực hoặc hoạt tính dược lý trên các thụ thể dopamin, muscarinic, histamin, benzodiazepin, adrenergic.

#### Dược động học

**Hấp thu:**

**Viên:** Sau khi uống, sumatriptan hấp thu nhanh, 70% nồng độ tối đa đạt được trong 45 phút. Thuốc khởi phát tác dụng sau khi uống 30 phút. Do chuyển hóa bước đầu ở gan và một phần do hấp thu không hoàn toàn, sinh khả dụng tuyệt đối dạng viên chỉ đạt khoảng 15%. Thức ăn không ảnh hưởng đáng kể đến sinh khả dụng của sumatriptan nhưng kéo dài thời gian đạt nồng độ đỉnh của thuốc.

**Dung dịch xịt mũi:** Sau khi xịt, sumatriptan hấp thu nhanh, nồng độ huyết tương tối đa đạt được trong khoảng 1,5 giờ ở người lớn và 2 giờ ở thanh thiếu niên. Thuốc khởi phát tác dụng sau 15 - 30 phút. Sinh khả dụng tương đối khi so với đường tiêm dưới da của dạng xịt mũi khoảng 16%, một phần do chuyển hóa bước đầu ở gan.

**Dung dịch tiêm:** Sau khi tiêm dưới da, sinh khả dụng trung bình của thuốc 96%, nồng độ đỉnh đạt được sau 25 phút. Thời gian khởi phát tác dụng sau tiêm trung bình 10 phút.

**Phân bố:** Sau khi tiêm dưới da, sumatriptan phân bố nhanh và rộng khắp các mô trong cơ thể. Thể tích phân bố: 2,4 lít/kg. Sumatriptan gắn khoảng 14 - 21% vào protein huyết tương. Sumatriptan không qua hàng rào máu - não một lượng đáng kể ở động vật; tuy vậy, khi điều trị sumatriptan ở người, một số tác dụng phụ như chóng mặt, ngủ gà, buồn ngủ đã được ghi nhận cho thấy thuốc phần nào vào não. Một lượng nhỏ sumatriptan qua nhau thai theo cơ chế khuếch tán thụ động. Sumatriptan cũng được phân bố vào sữa; ở động vật, nồng độ sumatriptan trong sữa cao gấp 8 lần trong huyết tương mẹ. **Chuyển hóa:** Sumatriptan chuyển hóa ở gan và có thể cả ở đường tiêu hóa. Nghiên cứu *in vitro* cho thấy sumatriptan được chuyển hóa bởi mono-oxidase (MAO), chủ yếu là isoenzym A (MAO-A); các chất ức chế enzym này có thể làm tăng nồng độ toàn thân của sumatriptan. Chất chuyển hóa chính của sumatriptan là chất tương tự indol acid acetic không có hoạt tính.

**Thải trừ:** Nửa đời thải trừ của thuốc vào khoảng 2 - 3 giờ. Sumatriptan được thải trừ theo cơ chế lọc cầu thận và bài tiết ở ống thận, tuy nhiên thành thải huyết tương qua thận chỉ chiếm 22% thành thải toàn thân. Do đường thải trừ chủ yếu là chuyển hóa ở gan, giảm thải trừ sumatriptan qua thận ít có ý nghĩa lâm sàng. Tỷ lệ thải trừ qua thận giữa dạng không đổi và dạng chất chuyển hóa indol acid acetic của các đường dùng thuốc như sau: đường xịt mũi (3% dưới dạng không đổi, 42% dạng chất chuyển hóa), đường uống (3% dưới dạng không đổi, 60% dưới dạng chuyển hóa), đường tiêm dưới da (22% dưới dạng không đổi, 38% dưới dạng chuyển hóa).

#### Chỉ định

Điều trị đau nửa đầu cấp (migrain).

Điều trị cơn cấp của đau đầu chuỗi (đau đầu từng cơn - cluster headache).

#### Chống chỉ định

Quá mẫn với sumatriptan.