

Rx

**VINXIUM**

"Thuốc này chỉ dùng theo đơn thuốc"

"Để xa tầm tay trẻ em"

"Đọc kỹ hướng dẫn sử dụng trước khi dùng"

**Thành phần công thức của thuốc:**

\* Cho 01 lọ thuốc tiêm đông khô:

Thành phần dược chất: Esomeprazol (dưới dạng esomeprazol natri)...40 mg

Thành phần tá dược: Manitol, dinatri edetat vđ .....1 lọ

\* Cho 01 ống dung môi pha tiêm:

Natri clorid.....45 mg

Nước để pha thuốc tiêm vđ..... 5,0 ml

**Dạng bào chế:**

Dạng bào chế: Thuốc tiêm đông khô

Hình thức:

- Lọ thuốc tiêm đông khô: Bột đông khô màu trắng đến trắng ngà, đóng trong lọ thủy tinh đầy kín bằng nút cao su và có nắp nhôm bên ngoài.

- Ống dung môi pha tiêm: Chế phẩm là dung dịch trong, được đóng trong ống thủy tinh, hàn kín, không rạn nứt, không đen đầu.

pH lọ thuốc tiêm đông khô sau khi pha trong dung môi: 10,0 ÷ 12,0

**Chỉ định:***Người lớn:*

Điều trị kháng tiết dịch vị khi liệu pháp đường uống không thích hợp, như:

- Bệnh trào ngược dạ dày - thực quản (GORD) trên bệnh nhân viêm thực quản và/hoặc các triệu chứng trào ngược nặng.

- Điều trị loét dạ dày, tá tràng do sử dụng thuốc chống viêm không steroid (NSAID).

- Dự phòng loét dạ dày, tá tràng do sử dụng thuốc NSAID ở những bệnh nhân có nguy cơ.

Phòng ngừa tái xuất huyết sau khi điều trị nội soi xuất huyết cấp tính do loét dạ dày hay loét tá tràng.

*Trẻ em và thanh thiếu niên từ 1 - 18 tuổi:* Điều trị kháng tiết dịch vị khi liệu pháp đường uống không thích hợp, ví dụ như: Bệnh trào ngược dạ dày - thực quản (GORD) ở bệnh nhân viêm thực quản trào ngược và/hoặc các triệu chứng trào ngược nặng.**Liều dùng - cách dùng:****Liều dùng:**

Thông thường điều trị tiêm tĩnh mạch nên thực hiện trong thời gian ngắn và chuyển sang điều trị bằng đường uống càng sớm càng tốt.

*Người lớn*

Điều trị kháng tiết dịch vị khi liệu pháp đường uống không thích hợp:

Điều trị viêm thực quản trào ngược: Liều thông thường 40 mg mỗi ngày một lần.

Điều trị triệu chứng cho bệnh trào ngược: Liều thông thường 20 mg mỗi ngày một lần.

Điều trị loét dạ dày, tá tràng do dùng thuốc NSAID: Liều thông thường 20 mg mỗi ngày một lần.

Phòng ngừa loét dạ dày và tá tràng do dùng thuốc NSAID ở những bệnh nhân có nguy cơ: Liều thông thường 20 mg mỗi ngày một lần.

Phòng ngừa tái xuất huyết sau khi điều trị nội soi xuất huyết cấp tính do loét dạ dày hay loét tá tràng: Tiêm truyền tĩnh mạch nhanh liều 80 mg trong 30 phút, tiếp theo là truyền tĩnh mạch liên tục 8 mg/giờ trong 3 ngày (72 giờ).

Nên chuyển sang dùng thuốc kháng acid đường uống ngay khi có thể.

*Trẻ em và thanh thiếu niên từ 1 - 18 tuổi*

Điều trị kháng tiết dịch vị khi liệu pháp đường uống không thích hợp với liều khuyến cáo:

Nhóm tuổi	Điều trị viêm thực quản trào ngược	Điều trị triệu chứng GORD
1 - 11 tuổi	Trọng lượng < 20 kg: 10 mg mỗi ngày một lần Trọng lượng ≥ 20 kg: 10 mg hoặc 20 mg mỗi ngày một lần	10 mg mỗi ngày một lần
12 - 18 tuổi	40 mg mỗi ngày một lần	20 mg mỗi ngày một lần

*Bệnh nhân suy thận*

Không cần điều chỉnh liều ở bệnh nhân suy thận. Tuy nhiên, do kinh nghiệm điều trị ở những bệnh nhân suy thận nặng còn thiếu, bệnh nhân nên được điều trị cẩn thận.

*Bệnh nhân suy gan*

GORD: Không cần điều chỉnh liều ở bệnh nhân suy gan từ nhẹ đến trung bình. Đối với bệnh nhân suy gan nặng, không nên vượt quá liều tối đa 20 mg esomeprazol hàng ngày.

Phòng ngừa xuất huyết tái phát trong chảy máu dạ dày cấp tính hoặc loét tá tràng sau khi được điều trị bằng nội soi: Không cần điều chỉnh liều ở bệnh nhân suy gan từ nhẹ đến trung bình. Đối với bệnh nhân suy gan nặng, tiêm truyền tĩnh mạch liều 80 mg esomeprazol trong 30 phút, sau đó tiêm truyền tĩnh mạch liên tục 4 mg/giờ trong 71,5 giờ (xem thêm mục "Dược động học").

*Bệnh nhân cao tuổi:* Không cần điều chỉnh liều ở bệnh nhân cao tuổi.**Cách dùng:***Chuẩn bị dung dịch tiêm tĩnh mạch:* Hút 5 ml dung dịch natri clorid 0,9% trong ống dung môi pha tiêm bơm vào lọ thuốc tiêm đông khô, lắc cho tan hoàn toàn. Tiêm tĩnh mạch trong ít nhất 3 phút. Dung dịch không sử dụng phải loại bỏ.*Chuẩn bị dung dịch tiêm truyền tĩnh mạch:* Hòa tan hoàn toàn bột thuốc trong 1 lọ hoặc 2 lọ thuốc tiêm đông khô (chứa 40 mg hoặc 80 mg esomeprazol) và pha loãng tới 100 ml bằng cùng dung dịch natri clorid 0,9%. Tiêm truyền tĩnh mạch trong khoảng thời gian từ 10 đến 30 phút.

Dung dịch không sử dụng phải loại bỏ.

Không có yêu cầu đặc biệt về xử lý thuốc sau khi sử dụng.

Dung dịch sau khi pha ổn định về mặt vật lý và hóa học trong vòng 24 giờ ở nhiệt độ dưới 30°C. Tuy nhiên, xét về mặt vi sinh vật, dung dịch sau khi pha nên được sử dụng ngay. Nếu không được sử dụng ngay, thời gian lưu trữ là trách nhiệm của người sử dụng và thường không dài hơn 12 giờ ở 2 - 8°C, trừ khi việc pha chế được diễn ra trong điều kiện vô khuẩn được kiểm soát.

**Chống chỉ định:**

Quá mẫn với esomeprazol hoặc các benzimidazol khác hoặc với bất kỳ thành phần nào của thuốc

Esomeprazol không nên dùng đồng thời với nelfinavir (xem thêm mục "Tương tác thuốc").

**Cảnh báo và thận trọng khi dùng thuốc:**

Khi có bất kỳ triệu chứng báo động nào (ví dụ như giảm cân, nôn tái phát, khó nuốt, xuất huyết hoặc phân đen) và khi nghi ngờ hoặc xuất huyết dạ dày, nên loại trừ bệnh ác tính do esomeprazol có thể che lấp triệu chứng và làm chậm chẩn đoán.

*Nhiễm khuẩn đường tiêu hóa*Điều trị bằng thuốc ức chế bơm proton (PPIs) có thể dẫn đến tăng nguy cơ nhiễm khuẩn đường tiêu hóa như *Salmonella* và *Campylobacter*.*Hấp thu vitamin B<sub>12</sub>*Esomeprazol, cũng như tất cả các loại thuốc kháng acid khác, có thể làm giảm sự hấp thu vitamin B<sub>12</sub> (cyanocobalamin). Điều này cần được xem xét ở những bệnh nhân có các yếu tố nguy cơ làm giảm hấp thu vitamin B<sub>12</sub> khi điều trị kéo dài.*Hạ magnesi máu:* Hạ magnesi máu nghiêm trọng đã được báo cáo ở những bệnh nhân được điều trị bằng thuốc PPIs như esomeprazol trong ít nhất ba tháng và hầu hết các trường hợp trong một năm. Các biểu hiện nghiêm trọng của hạ magnesi máu như mệt mỏi, đau thắt lưng, co giật, chóng mặt và loạn nhịp thất xuất hiện nhưng có thể âm thầm và bị bỏ qua. Ở những bệnh nhân bị ảnh hưởng nhất, giảm magnesi máu được cải thiện sau khi bổ sung magnesi và ngừng dùng PPIs.

Đối với bệnh nhân dự kiến điều trị kéo dài hoặc dùng PPIs cùng với digoxin hoặc các loại thuốc có thể gây ra hạ magnesi máu (ví dụ, thuốc lợi tiểu), nên xem xét đo nồng độ magnesi trước khi bắt đầu điều trị PPIs và định kỳ trong quá trình điều trị.

*Gãy xương:* Thuốc ức chế bơm proton, đặc biệt nếu dùng liều cao và trong thời gian dài (trên 1 năm), có thể làm tăng nguy cơ gãy xương hông, cổ tay và gãy cột sống, chủ yếu ở người cao tuổi hoặc người có các yếu tố nguy cơ khác. Các nghiên cứu theo dõi cho thấy các chất ức chế bơm proton có thể làm tăng nguy cơ gãy xương lên 10 - 40%. Một số gia tăng này có thể là do các yếu tố nguy cơ khác. Bệnh nhân có nguy cơ bị loãng xương nên được chăm sóc theo hướng dẫn lâm sàng và cần phải uống đủ lượng vitamin D và calci.*Kết hợp với các loại thuốc khác*

Không nên dùng đồng thời atazanavir với thuốc ức chế bơm proton (xem thêm mục "Tương tác thuốc"). Nếu kết hợp atazanavir với thuốc ức chế bơm proton được đánh giá là không thể tránh khỏi, nên theo dõi giám sát lâm sàng chặt chẽ (ví dụ định lượng vi rút) kết hợp với tăng liều atazanavir lên 400 mg với 100 mg ritonavir; esomeprazol không nên vượt quá liều 20 mg.

Esomeprazol là một chất ức chế vừa phải CYP2C19. Khi bắt đầu hoặc kết thúc điều trị với esomeprazol, cần xem xét khả năng tương tác với thuốc chuyển hóa qua CYP2C19. Một sự tương tác được quan sát thấy giữa clopidogrel và esomeprazol. Sự liên quan lâm sàng của sự tương tác này là không chắc chắn. Để phòng ngừa, không nên sử dụng đồng thời esomeprazol và clopidogrel.

*Ảnh hưởng đến kết quả xét nghiệm:* Acid dạ dày giảm làm tăng Chromogranin A (CgA) có thể gây trở ngại cho việc xác định các khối u thần kinh. Để tránh ảnh hưởng này, nên ngừng dùng esomeprazol ít nhất 5 ngày trước khi đo CgA. Nếu nồng độ CgA và gastrin không quay trở lại phạm vi tham chiếu sau khi đo ban đầu, phải tiến hành đo lại 14 ngày sau khi ngừng điều trị thuốc ức chế bơm proton.

Như trong tất cả các phương pháp điều trị dài hạn, đặc biệt là khi vượt quá thời gian điều trị là 1 năm, bệnh nhân nên được theo dõi thường xuyên.

*Bệnh lupus ban đỏ dưới da (SCLE):* Thuốc ức chế bơm proton có liên quan đến các trường hợp SCLE rất hiếm. Nếu tổn thương xảy ra, đặc biệt là ở vùng da tiếp xúc với ánh nắng mặt trời, và nếu kèm theo đau khớp, cần ngừng dùng esomeprazol tiêm. Khi SCLE xảy ra sau khi điều trị với esomeprazol có thể làm tăng nguy cơ xảy ra SCLE với các thuốc ức chế bơm proton khác.

Thuốc này chứa ít hơn 1 mmol natri (23 mg) cho mỗi liều, về cơ bản là "không có natri".

**Sử dụng thuốc cho phụ nữ có thai và cho con bú:****Sử dụng thuốc cho phụ nữ có thai:**

Các nghiên cứu trên động vật với esomeprazol không chỉ ra tác dụng có hại trực tiếp hoặc gián tiếp đối với sự phát triển phôi/thai nhi. Một lượng dữ liệu vừa phải trên phụ nữ mang thai (từ 300 - 1000 kết quả) cho thấy không có độc tính dị ứng hoặc độc tính trên phôi thai/trẻ sơ sinh của esomeprazol. Tuy nhiên, để thận trọng, chỉ nên dùng thuốc nếu lợi ích vượt trội so với nguy cơ.

**Sử dụng thuốc cho phụ nữ cho con bú:**

Esomeprazol không biết liệu có được bài tiết trong sữa mẹ hay không. Không có nghiên cứu ở phụ nữ cho con bú đã được thực hiện. Do đó không nên sử dụng esomeprazol trong thời gian cho con bú.

**Ảnh hưởng của thuốc lên khả năng lái xe, vận hành máy móc:**

Esomeprazol có ảnh hưởng rất nhỏ đến khả năng lái xe hoặc vận hành máy móc. Các phản ứng bất lợi như chóng mặt (ít gặp) và mờ mắt (ít gặp) đã được báo cáo. Nếu bệnh nhân bị ảnh hưởng, không nên lái xe hoặc vận hành máy móc.

**Tương tác thuốc:****Ảnh hưởng của esomeprazol đối với dược động học của các thuốc khác****Chất ức chế protease**

Omeprazol đã được báo cáo là tương tác với một số chất ức chế protease. Tầm quan trọng lâm sàng và các cơ chế đằng sau những tương tác được báo cáo này không phải lúc nào cũng được biết đến. Tăng pH dạ dày trong điều trị với omeprazol có thể làm thay đổi sự hấp thu của các chất ức chế protease. Các cơ chế tương tác khác có thể là thông qua sự ức chế CYP2C19.

Đối với atazanavir và nelfinavir, nồng độ huyết thanh giảm đã được báo cáo khi dùng đồng thời với omeprazol. Không nên dùng đồng thời omeprazol với nelfinavir hoặc atazanavir. Dùng đồng thời omeprazol (40 mg mỗi ngày một lần) với atazanavir 300 mg/ritonavir 100 mg cho người tình nguyện khỏe mạnh dẫn đến giảm đáng kể phơi nhiễm atazanavir (giảm khoảng 75% AUC, C<sub>max</sub> và C<sub>min</sub>). Tăng liều atazanavir lên 400 mg không bù lại được tác động của omeprazol đối với phơi nhiễm atazanavir. Việc dùng đồng thời omeprazol (20 mg mỗi ngày một lần) với atazanavir 400 mg/ritonavir 100 mg cho người tình nguyện khỏe mạnh dẫn đến giảm khoảng 30% phơi nhiễm atazanavir so với nhóm chỉ sử dụng atazanavir 300 mg/ritonavir 100 mg mỗi ngày một lần. Sử dụng đồng thời omeprazol (40 mg mỗi ngày một lần) với nelfinavir làm giảm AUC, C<sub>max</sub>, C<sub>min</sub> xuống 36 - 39%. Do đặc tính dược lực học và dược động học của omeprazol và esomeprazol tương đồng nhau, dùng đồng thời esomeprazol và atazanavir không được khuyến cáo, dùng đồng thời esomeprazol và nelfinavir được chống chỉ định.

Đối với saquinavir (đồng thời với ritonavir), nồng độ huyết thanh tăng lên 80 - 100% đã được báo cáo trong điều trị đồng thời với omeprazol (40 mg mỗi ngày một lần). Điều trị đồng thời với omeprazol (20 mg mỗi ngày một lần) không ảnh hưởng đến sự tiếp xúc của darunavir (đồng thời với ritonavir) và amprenavir (đồng thời với ritonavir). Điều trị đồng thời với esomeprazol (20 mg mỗi ngày một lần) không ảnh hưởng đến việc tiếp xúc với amprenavir (có và không có ritonavir đồng thời). Điều trị bằng omeprazol (40 mg mỗi ngày một lần) không ảnh hưởng đến sự tiếp xúc của lopinavir (đồng thời với ritonavir).

**Methotrexat**

Khi dùng cùng với chất ức chế bơm proton, nồng độ methotrexat đã được báo cáo là tăng ở một số bệnh nhân. Do đó, khi sử dụng methotrexat liều cao cần ngừng dùng esomeprazol tạm thời.

**Tacrolimus**

Việc sử dụng đồng thời esomeprazol đã được báo cáo là làm tăng nồng độ tacrolimus huyết thanh. Cần phải tăng cường theo dõi nồng độ tacrolimus cũng như chức năng thận (độ thanh thải creatinin) và liều lượng của tacrolimus được điều chỉnh nếu cần.

**Các chất có khả năng hấp thu phụ thuộc pH**

Do ức chế tiết acid của dạ dày, esomeprazol và các PPIs khác có thể làm giảm hoặc tăng sự hấp thu các thuốc có sinh khả dụng phụ thuộc vào pH ở dạ dày. Sự hấp thu của một số azol chống nấm như ketoconazol, itraconazol, posaconazol và các thuốc



khác như erlotinib có thể giảm và sự hấp thu digoxin có thể tăng lên khi điều trị đồng thời với esomeprazol.

Điều trị đồng thời với omeprazol (20 mg mỗi ngày một lần) và digoxin ở những người khỏe mạnh làm tăng khả dụng sinh học của digoxin lên 10%. Độc tính digoxin hiếm khi được báo cáo. Tuy nhiên cần thận trọng khi dùng omeprazol liều cao ở bệnh nhân cao tuổi. Theo dõi khi điều trị cùng với digoxin nên được tăng cường.

**Các thuốc được chuyển hóa bởi CYP2C19**

Esomeprazol ức chế CYP2C19, enzym chuyển hóa chính của esomeprazol.

Ví vậy, khi esomeprazol kết hợp với các thuốc chuyển hóa bởi CYP2C19 như diazepam, citalopram, imipramin, clomipramin, phenytoin,..., nồng độ trong huyết tương của các thuốc này có thể tăng lên và cần giảm liều. Không có nghiên cứu tương tác *in vivo* nào được thực hiện với phác đồ tiêm tĩnh mạch liều cao (80 mg + 8 mg/giờ). Hiệu quả của esomeprazol đối với các thuốc chuyển hóa bởi CYP2C19 có thể rõ rệt hơn trong phác đồ này, và bệnh nhân cần được theo dõi chặt chẽ về các tác dụng không mong muốn trong thời gian điều trị bằng đường tĩnh mạch trong 3 ngày.

**Diazepam**

Dùng đồng thời 30 mg esomeprazol dẫn đến giảm 45% độ thanh thải của diazepam.

**Phenytoin**

Dùng đồng thời 40 mg esomeprazol và phenytoin làm tăng 13% nồng độ phenytoin trong huyết tương ở những bệnh nhân động kinh. Khuyến cáo theo dõi nồng độ trong huyết tương của phenytoin khi điều trị đồng thời với esomeprazol.

**Voriconazol**

Omeprazol (40 mg mỗi ngày một lần) làm tăng C<sub>max</sub> và AUC của voriconazol lần lượt là 15% và 41%.

**Cilostazol**

Omeprazol cũng như esomeprazol hoạt động như chất ức chế CYP2C19. Omeprazol, liều 40 mg cho các đối tượng khỏe mạnh trong một nghiên cứu chéo cho thấy, tăng C<sub>max</sub> và AUC của cilostazol lần lượt là 18% và 26%, và một trong các chất chuyển hóa hoạt động tương ứng là 29% và 69%.

**Cisaprid**

Ở những người tình nguyện khỏe mạnh, dùng đồng thời 40 mg esomeprazol và cisaprid dẫn đến tăng 32% diện tích dưới đường cong (AUC) và thời gian bán thải kéo dài 31% nhưng không có sự gia tăng đáng kể nồng độ đỉnh trong huyết tương của cisaprid. Khoảng QTc kéo dài một chút được quan sát sau khi dùng cisaprid một mình, không được kéo dài hơn nữa khi cisaprid dùng đồng thời với esomeprazol.

**Warfarin**

Dùng đồng thời 40 mg esomeprazol cho bệnh nhân được điều trị warfarin trong một thử nghiệm lâm sàng cho thấy rằng thời gian đông máu nằm trong phạm vi được chấp nhận. Tuy nhiên, có một vài trường hợp có INR cao có ý nghĩa lâm sàng đã được báo cáo trong điều trị đồng thời. Nên theo dõi cẩn thận khi bắt đầu và kết thúc điều trị esomeprazol trong trường hợp dùng đồng thời với warfarin hoặc các dẫn xuất coumarin khác.

**Clopidogrel**

Kết quả từ các nghiên cứu đã chỉ ra tương tác dược động học/dược lực học giữa clopidogrel (liều 300 mg/liều duy trì 75 mg/mỗi ngày) và esomeprazol (40 mg/ngày). Kết quả là giảm tiếp xúc với các chất chuyển hóa có hoạt tính của clopidogrel xuống 40% và dẫn đến giảm sự ức chế tối đa sự xâm lấn tiểu cầu trung bình 14%.

Khi clopidogrel được sử dụng với một liều phối hợp cố định của esomeprazol 20 mg + ASA 81 mg so với sử dụng một mình clopidogrel trong một nghiên cứu ở người khỏe mạnh cho thấy, giảm tiếp xúc của gần 40% các chất chuyển hóa có hoạt tính của clopidogrel. Tuy nhiên, mức độ ức chế tiểu cầu tối đa trong các đối tượng này là như nhau trong clopidogrel và clopidogrel + nhóm kết hợp (esomeprazol + ASA).

Dữ liệu không nhất quán về những ảnh hưởng lâm sàng của sự tương tác dược động học/dược lực học của esomeprazol về các biến cố tim mạch chính đã được báo cáo từ các nghiên cứu quan sát và lâm sàng. Để phòng ngừa, việc sử dụng đồng thời clopidogrel với esomeprazol không được khuyến khích.

**Các thuốc không có tương tác có liên quan trên lâm sàng**

**Amoxicilin hoặc quinidin**

Esomeprazol đã được chứng minh là không có tác dụng lâm sàng liên quan đến dược động học của amoxicilin hoặc quinidin.

**Naproxen hoặc rofecoxib**

Các nghiên cứu đánh giá việc dùng đồng thời esomeprazol và naproxen hoặc rofecoxib không xác định được bất kỳ tương tác dược động học nào có liên quan lâm sàng trong các nghiên cứu ngắn hạn.

**Ảnh hưởng của các thuốc khác đến dược động học của esomeprazol**

**Các thuốc ức chế CYP2C19 và/hoặc CYP3A4**

Esomeprazol được chuyển hóa bởi CYP2C19 và CYP3A4. Dùng đồng thời esomeprazol và chất ức chế CYP3A4 như clarithromycin làm tăng gấp đôi phơi nhiễm AUC với esomeprazol. Sử dụng đồng thời esomeprazol và một chất ức chế kết hợp CYP2C19 và CYP 3A4 có thể dẫn đến tăng gấp đôi sự tiếp xúc với esomeprazol. Voriconazol, chất ức chế CYP2C19 và CYP3A4, làm tăng AUC của omeprazol lên 280%. Liều cao esomeprazol vẫn được dung nạp tốt nên việc điều chỉnh liều của esomeprazol là không cần thiết. Tuy nhiên, điều chỉnh liều nên được xem xét ở những bệnh nhân suy gan nặng hoặc điều trị kéo dài.

**Các thuốc gây cảm ứng CYP2C19 và/hoặc CYP3A4**

Các thuốc gây cảm ứng CYP2C19 hoặc CYP3A4 hoặc cả hai (như rifampicin và cỏ wort St. John) có thể làm giảm nồng độ esomeprazol huyết thanh bằng cách tăng tỷ lệ chuyển hóa của esomeprazol.

**Tương kỵ thuốc:**

Do không có các nghiên cứu về tính tương kỵ của thuốc, không trộn lẫn thuốc này với các thuốc khác, ngoại trừ dung dịch được liệt kê ở mục "Liều dùng - cách dùng".

**Tác dụng không mong muốn của thuốc (ADR):**

*Thường gặp, 1/100 ≤ ADR < 1/10*

Rối loạn hệ thần kinh: Nhức đầu

Rối loạn tiêu hóa: Đau bụng, táo bón, tiêu chảy, đầy hơi, buồn nôn/nôn.

**Rối loạn da và mô dưới da: Phản ứng tại vị trí tiêm.**

*Ít gặp, 1/1000 ≤ ADR < 1/100*

Rối loạn chuyển hóa và dinh dưỡng: Phù ngoại biên

Rối loạn tâm thần: Mất ngủ

Rối loạn hệ thần kinh: Chóng mặt, dị cảm, buồn ngủ

Rối loạn mắt: Mờ mắt

Rối loạn tiêu hóa: Khô miệng.

Rối loạn gan mật: Tăng enzym gan.

Rối loạn cơ - xương và mô liên kết: Gãy xương hông, cổ tay hoặc cột sống.

Rối loạn da và mô dưới da: Viêm da, ngứa, phát ban, nổi mề đay

*Hiếm gặp, 1/10000 ≤ ADR < 1/1000*

Máu và rối loạn hệ thống bạch huyết: Giảm bạch cầu, giảm tiểu cầu

Rối loạn hệ thống miễn dịch: Các phản ứng quá mẫn như sốt, phù mạch và phản ứng/sốc phản vệ.

Rối loạn chuyển hóa và dinh dưỡng: Hạ natri huyết.

Rối loạn tâm thần: Kích động, lú lẫn, trầm cảm.

Rối loạn hệ thần kinh: Rối loạn vị giác.

Rối loạn hô hấp, lồng ngực và trung thất: Co thắt phế quản.

Rối loạn tiêu hóa: Viêm miệng, nhiễm nấm *Candida* đường tiêu hóa.

Rối loạn gan mật: Viêm gan có hoặc không có vàng da.

Rối loạn cơ - xương và mô liên kết: Đau khớp, đau cơ.

Rối loạn toàn thân: Mệt mỏi, tăng tiết mồ hôi.

Rối loạn da và mô dưới da: Rụng tóc, nhạy cảm ánh sáng.

*Rất hiếm gặp, ADR < 1/10000*

Máu và rối loạn hệ thống bạch huyết: Tăng bạch cầu hạt, giảm toàn thể huyết cầu.

Rối loạn tâm thần: Hung hăng, ảo giác.

Rối loạn gan mật: Suy gan, bệnh não ở những bệnh nhân mắc bệnh gan từ trước.

Rối loạn cơ - xương và mô liên kết: Yếu cơ.

Rối loạn thận và tiết niệu: Viêm thận kẽ; ở một số bệnh nhân, suy thận đã được báo cáo.

Hệ thống sinh sản và rối loạn vú: Vú to ở nam.

Rối loạn da và mô dưới da: Hồng ban đa dạng, hội chứng Stevens - Johnson, hoại tử biểu bì nhiễm độc (TEN).

*Không thể ước tính được từ dữ liệu có sẵn*

Rối loạn chuyển hóa và dinh dưỡng: Hạ magesi máu, có thể tương quan với hạ calci máu. Hạ magesi máu cũng có thể liên quan đến hạ kali máu.

Rối loạn tiêu hóa: Viêm đại tràng.

Rối loạn da và mô dưới da: Bệnh lupus ban đỏ da bán cấp.

**"Thông báo ngay cho bác sỹ hoặc dược sỹ những phản ứng có hại gặp phải khi sử dụng thuốc"**

**Quá liều và cách xử trí:**

Chưa có báo cáo về quá liều esomeprazol tiêm ở người.

*Xử trí:* Không có thuốc giải độc đặc hiệu. Chủ yếu là điều trị triệu chứng và hỗ trợ. Esomeprazol gắn nhiều với protein huyết và do đó thẩm tách máu không làm tăng thải trừ thuốc. Tích cực theo dõi để có biện pháp xử trí kịp thời.

**Đặc tính dược lực học:**

Mã ATC: A02BC05

Esomeprazol là đồng phân S của omeprazol, là chất ức chế bơm proton.

**Cơ chế hoạt động**

Esomeprazol gắn với H<sup>+</sup>/K<sup>+</sup> - ATPase ở thành tế bào dạ dày, ức chế đặc hiệu hệ thống enzym này, ngăn cản bước cuối cùng của sự bài tiết acid vào lòng dạ dày. Do vậy, esomeprazol có tác dụng ức chế dạ dày bài tiết các acid cơ bản và cả khi bị kích thích do bất kỳ nguyên nhân nào.

**Đặc tính dược động học:**

**Hấp thu**

Sau liều 40 mg esomeprazol tiêm tĩnh mạch lặp lại nhiều lần, nồng độ đỉnh trung bình trong huyết tương là khoảng 13,6 micromol/lit.

**Phân bố**

Thể tích phân bố ở trạng thái ổn định ở người khỏe mạnh là khoảng 0,22 lít/kg trọng lượng cơ thể. Khoảng 97% esomeprazol gắn với protein huyết tương.

**Chuyển hóa**

Esomeprazol được chuyển hóa chủ yếu ở gan qua hệ thống cytochrom P450 (CYP), chủ yếu bởi CYP2C19 tạo thành hai chất chuyển hóa chính là hydroxy và desmethyl esomeprazol không còn hoạt tính. Phần còn lại chuyển hóa bởi isoenzym CYP3A4 thành esomeprazol sulfon.

**Thải trừ**

Tổng độ thanh thải huyết tương là khoảng 17 lít/giờ sau một liều duy nhất và khoảng 9 lít/giờ sau khi dùng liều lặp lại. Thời gian bán thải huyết tương là khoảng 1,3 giờ sau khi dùng lặp đi lặp lại liều hàng ngày. Nồng độ AUC tăng khi dùng esomeprazol lặp lại nhiều lần. Sự gia tăng này phụ thuộc vào liều và kết quả là mối quan hệ giữa liều - AUC phi tuyến tính sau khi dùng lặp lại. Sự phụ thuộc liều lượng và thời gian này là do sự chuyển hóa lần đầu và độ thanh thải toàn thân giảm, có thể do sự ức chế enzym CYP2C19 của esomeprazol và/hoặc chất chuyển hóa sulfon của nó.

Không có hiện tượng tích lũy thuốc khi dùng mỗi ngày một lần.

Các chất chuyển hóa chính của esomeprazol không còn hoạt tính. Gần 80% liều dùng được bài tiết dưới dạng các chất chuyển hóa trong nước tiểu, phần còn lại trong phân. Dưới 1% thuốc gốc được tìm thấy trong nước tiểu.

**Đối tượng đặc biệt**

**Người chuyển hóa kém**

Khoảng 2,9 ± 1,5% dân số thiếu enzym CYP2C19 chức năng và được gọi là những người chuyển hóa kém. Ở những người này, sự chuyển hóa lần đầu của esomeprazol có lẽ chủ yếu được xúc tác bởi CYP3A4. Sau khi lặp đi lặp lại liều 40 mg esomeprazol một lần mỗi ngày tiêm tĩnh mạch, tổng phơi nhiễm trung bình cao hơn khoảng 100% ở người chuyển hóa kém hơn so với đối tượng có enzym CYP2C19 chức năng (người chuyển hóa tốt). Nồng độ đỉnh trong huyết tương trung bình tăng khoảng 60%. Những phát hiện này không có ý nghĩa đối với liều dùng của esomeprazol.

**Suy gan**

Sự chuyển hóa lần đầu của esomeprazol ở bệnh nhân suy gan từ nhẹ đến trung bình có thể bị giảm. Tỷ lệ chuyển hóa giảm ở những bệnh nhân có suy gan nặng dẫn đến tăng gấp đôi lượng tiếp xúc của esomeprazol. Do đó, không nên vượt quá liều tối đa 20 mg ở bệnh nhân GORD bị gan nặng. Để phòng ngừa xuất huyết tái phát trong chảy máu dạ dày cấp tính hoặc loét tá tràng sau khi được điều trị bằng nội soi ở bệnh nhân suy gan nặng, sau liều tiêm truyền tĩnh mạch ban đầu 80 mg trong 30 phút, liều tiêm truyền tĩnh mạch liên tục tối đa 4 mg/giờ trong 71,5 giờ có thể là đủ. Esomeprazol và các chất chuyển hóa chính của nó không có xu hướng tích lũy với liều dùng một lần mỗi ngày.

**Suy thận**

Chưa có nghiên cứu nào được thực hiện ở những bệnh nhân suy thận. Vì thận là nơi bài tiết các chất chuyển hóa của esomeprazol nhưng không phải để loại bỏ hợp chất gốc, sự chuyển hóa lần đầu của esomeprazol không được dự kiến sẽ thay đổi ở những bệnh nhân suy thận.

**Người cao tuổi**

Sự chuyển hóa lần đầu của esomeprazol không thay đổi đáng kể ở những người cao tuổi (71 - 80 tuổi).

**Quy cách đóng gói:** Hộp 1 lọ thuốc tiêm đông khô và 1 ống dung môi 5 ml. Hộp 5 lọ thuốc tiêm đông khô và 5 ống dung môi 5 ml. Hộp 10 lọ thuốc tiêm đông khô.

**Điều kiện bảo quản:** Nơi khô ráo, nhiệt độ dưới 30°C, tránh ánh sáng.

**Hạn dùng:**

Lọ thuốc tiêm đông khô và ống dung môi pha tiêm: 36 tháng kể từ ngày sản xuất.

Dung dịch sau khi pha: 24 giờ sau khi pha.

**Tiêu chuẩn chất lượng: TCCS**

**Tên, địa chỉ cơ sở sản xuất:**

CÔNG TY CỔ PHẦN DƯỢC PHẨM VINH PHÚC

Số 777 Đường Mê Linh - P. Khai Quang - TP. Vĩnh Yên - Tỉnh Vĩnh Phúc

ĐT: 02113 861233 Fax: 02113 862774

Địa chỉ nhà máy:

Thôn Mậu Thông - P. Khai Quang - TP. Vĩnh Yên - Tỉnh Vĩnh Phúc