https://nhathuocngocanh.com/

Rx - Thuốc kê đơn

ESO-DR 20

(Nang giải phóng chậm Esomeprazol Magnesi 20 mg)

HƯỚNG DẪN SỬ DỤNG

Đọc kỹ hướng dẫn sử dụng trước khi dùng. Để xa tầm tay trẻ em. Thông báo ngày cho bác sỹ hoặc dược sỹ những phản ứng có hại gặp phải khi sử dụng thuốc. Thuốc này chỉ dùng theo đơn thuốc. Nếu cần thêm thông tin xin hỏi ý kiến bác sĩ.

Thành phần:

Thành phần dược chất:

Mỗi nang giải phóng chậm chứa esomeprazol magnesi USP tương đương 20mg esomeprazol.

Thành phần tá dược: Sugar spheres (non parell seeds # 40/#60), hypromellose 2910, meglumin, poloxamer 188, sodium lauryl sulfate, methacrylic acid copolymer, triethyl citrate, glyceryl monostearate, talc, sodium hydroxide,

Dạng bào chế:

Viên nang gelatin vỏ cứng, cỡ số '3', màu tím, in chữ 'H' trên nắp nang và số '72' trên thân nang.

Chỉ định:

Loét dạ dày-tá tràng lành tính;

Phối hợp với kháng sinh trong tiệt trùng *H. Pylori*;

Hội chứng Zollinger-Ellison;

Bệnh trào ngược dạ dày- thực quản nặng (viêm thực quản trợt xước, loét hoặc thắt hẹp được xác định bằng nội soi);

Phòng và điều trị loét dạ dày-tá tràng do dùng thuốc chống viêm không steroid (NSAID)

Cách dùng, liều dùng:

Esomeprazol không ổn định trong môi trường acid, nên phải uống thuốc dưới dạng viên nang chứa các hạt bao tan trong ruột để không bị phá hủy ở dạ dày và tăng sinh khả dụng. Phải nuốt cả nang thuốc, không được nghiền nhỏ hoặc nhai. Tuy nhiên nếu người bệnh khó nuốt, có thể mở viên nang đổ từ từ các hạt thuốc bên trong nang vào một thìa canh nước đun sôi để nguội, hoặc nước táo, nước cam và uống ngay lập tức. Uống thuốc ít nhất 1 giờ trước bữa ăn.

Liều dùng cho người lớn:

Điều trị loét dạ dày – tá tràng có Helicobacter Pylori:

Esomeprazol là một thành phần trong phác đồ điều trị cùng với kháng sinh, ví dụ phác đồ 3 thuốc (cùng với amoxicinin và clarithromycin). Uống esomeprazol mỗi lần 20mg, ngày 2 lần trong 7 ngày, hoặc mỗi ngày một lần 40mg trong 10 ngày. (Amoxicinin mỗi lần 1,0g, ngày 2 lần và clarithromycin mỗi lần 500mg ngày 2 lần trong 7 ngày hoặc 10 ngày).

Điều trị bệnh trào ngược dạ dày – thực quản nặng có viêm thực quản:

Uống mỗi ngày một lần 20–40mg trong vòng 4–8 tuần, có thể uống thêm 4–8 tuần nữa nếu vẫn còn triệu chứng hoặc biểu hiện của viêm qua nội soi.

Điều trị duy trì sau khi đã khỏi viêm thực quản:

Uống mỗi ngày 1 lần, mỗi lần 20mg, có thể kéo dài tới 6 tháng.

Dự phòng loét dạ dày ở những người có nguy cơ cao về biến chứng ở dạ dày – tá tràng, nhưng có yêu cầu phải tiếp tục điều trị bằng thuốc chống viêm không steroid:

Uống mỗi ngày một lần 20mg.

Điều trị trào ngược dạ dày – thực quản có triệu chứng nhưng không bị viêm thực quản:

Uống mỗi ngày 1 lần 20mg trong 4 tuần, có thể uống thêm 4 tuần nữa nếu các triệu chứng chưa khỏi hoàn toàn.

Điều trị loét dạ dày do dùng thuốc chống viêm không steroid:

Uống mỗi ngày một lần 20mg trong 4 đến 8 tuần.

https://nhathuocngocanh.com/

Điều trị hội chứng Zollinger – Ellison:

Tùy theo cá thể và mức độ tăng tiết acid của dịch dạ dày, liều dùng mỗi ngày cao hơn trong các trường hợp khác, dùng một lần hoặc chia làm 2 lần trong ngày. Khi các triệu chứng đã kiểm soát được, có thể dùng phẫu thuật để cắt u. Nếu không cắt được bỏ u hoàn toàn, phải dùng thuốc lâu dài.

Người suy gan nặng không dùng quá 20 mg một ngày. Không cần phải giảm liều ở người suy gan nhẹ và trung bình, người suy thận hoặc người cao tuổi. Không dùng thuốc cho trẻ em.

Chống chỉ định:

Esomeprazol chống chỉ định ở bệnh nhân quá mẫn cảm với bất cứ thành phần nào của chế phẩm hoặc với các benzimidazol thay thế. Không được dùng esomeprazol đồng thời với nelfinavir.

Cảnh báo và thận trọng khi dùng thuốc:

Khi có sự hiện diện bất kỳ một triệu chứng báo động nào (như là giảm cân đáng kể không chủ ý, nôn tái phát, khó nuốt, nôn ra máu hay đại tiện phân đen) và khi nghi ngờ hoặc bị loét dạ dày, nên loại trừ bệnh lý ác tính vì điều trị bằng esomeprazol có thể làm giảm triệu chứng và làm chậm trễ việc chẩn đoán.

Điều trị dài hạn

Bệnh nhân điều trị thời gian dài (đặc biệt những người đã điều trị hơn 1 năm) nên được theo dõi thường xuyên.

Điều trị theo yêu cầu

Bệnh nhân điều trị theo yêu cầu nên liên hệ với bác sỹ nếu có các thay đổi về triệu chứng.

Tiệt trùng Helicobacter pylori

Khi kê toa esomeprazol để tiệt trùng *Helicobacter pylori*, nên xem xét các tương tác thuốc có thể xảy ra trong pháp đồ điều trị 3 thuốc. Clarithromycin là chất ức chế mạnh CYP3A4 và vì thế nên xem xét chống chỉ định và tương tác đối với clarithromycin khi dùng pháp đồ 3 thuốc cho bệnh nhân đang dùng các thuốc khác chuyển hóa qua CYP3A4 như cisaprid.

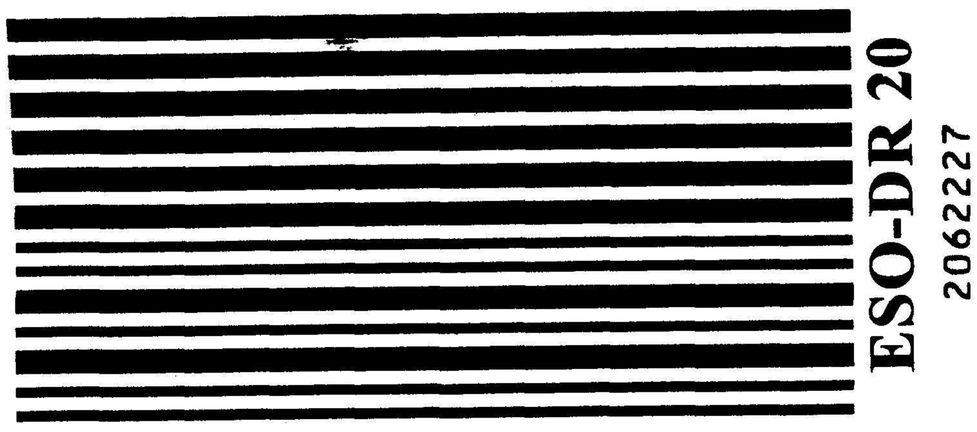
Nhiễm khuẩn đường tiêu hóa

Điều trị bằng thuốc ức chế bơm proton có thể dẫn đến tăng nhẹ nguy cơ nhiễm khuẩn đường tiêu hóa do *Salmonella* và *Campylobacter*.

Hấp thu vitamin B12

Esomeprazol, cũng như tất cả các thuốc kháng acid khác, có thể làm giảm hấp thu vitamin B12 (cyanocobalamin) do giảm hoặc thiếu acid dịch vị. Nên xem xét điều này ở những bệnh nhân có dự trữ vitamin B12 trong cơ thể giảm hoặc các yếu tố nguy cơ làm giảm hấp thu vitamin B12 khi điều trị lâu dài.

https://nhathuocngocanh.com/



Hạ magnesi huyết

Giảm magnesi huyết nghiêm trọng đã được báo cáo ở những bệnh nhân được điều trị bằng các thuốc ức chế bơm proton (PPI) như esomeprazol trong ít nhất ba tháng, và hầu hết các trường hợp trong một năm. Biểu hiện giảm magnesi huyết nghiêm trọng như mệt mỏi, co cứng cơ, mê sảng, co giật, chóng mặt và rối loạn nhịp thất có thể xảy ra nhưng chúng có thể bắt đầu âm thầm và bị bỏ qua. Ở hầu hết các bệnh nhân bị ảnh hưởng, có thể cải thiện tình trạng giảm magnesi huyết sau khi bổ sung magnesi và ngừng dùng thuốc ức chế bơm proton.

Đối với những bệnh nhân được điều trị kéo dài hoặc những bệnh nhân phải dùng các thuốc ức chế bơm proton với digoxin hoặc các loại thuốc khác có thể gây giảm magnesi huyết (ví dụ như thuốc lợi tiểu), các bác sỹ nên cân nhắc đo nồng độ magnesi trước khi bắt đầu điều trị với thuốc ức chế bơm proton và đo định kỳ trong khi điều trị.

Nguy cơ gãy xương

Thuốc ức chế bơm proton, đặc biệt nếu dùng liều cao và trong thời gian dài (> 1 năm), có thể làm tăng nguy cơ gãy xương hông, cổ tay và xương sống ở mức độ vừa, chủ yếu ở người cao tuổi hoặc có các yếu tố nguy cơ được công nhận khác. Các nghiên cứu quan sát cho thấy rằng các thuốc ức chế bơm proton có thể làm tăng tổng thể nguy cơ gãy xương khoảng 10-40%. Một số nguy cơ tăng này có thể là do các yếu tố nguy cơ khác. Bệnh nhân có nguy cơ loãng xương nên được chăm sóc theo hướng dẫn lâm sàng hiện hành và họ cần phải được bổ sung đầy đủ lượng vitamin D và canxi.

Hội chứng ban đỏ da bán cấp (SCLE)

Các thuốc ức chế bơm proton có liên quan đến rất ít các trường hợp hội chứng ban đỏ da bán cấp. Nếu các tổn thương xảy ra, đặc biệt là ở vùng da có tiếp xúc với ánh nắng, và nếu kèm theo đau khớp, bệnh nhân nên tìm kiếm sự trợ giúp y tế ngay và bác sỹ nên cân nhắc dừng omeprazol. Hội chứng ban đỏ da bán cấp sau khi điều trị với một loại thuốc ức chế bơm proton trước đó có thể làm tăng nguy cơ hội chứng ban đỏ da bán cấp với các thuốc ức chế bơm proton khác.

Kết hợp với các thuốc khác

Không khuyến cáo dùng đồng thời esomeprazol với atazanavir. Nếu sự phối hợp giữa atazanavir và chất ức chế bơm proton là không thể trách khỏi, cần theo dõi chặt chẽ trên lâm sàng khi tăng liều atazanavir đến 400mg với 100mg ritonavir, không nên sử dụng quá 20mg esomeprazol.

Esomeprazol là chất ức chế CYP2C19. Khi bắt đầu hay kết thúc điều trị với esomeprazol cần xem xét khả năng tương tác thuốc với các thuốc chuyển hóa qua CYP2C19. Đã có ghi nhận tương tác giữa clopidogrel và omeprazol. Sự liên quan lâm sàng của tương tác này là không chắc chắn. Để phòng ngừa, không nên dùng đồng thời esomeprazol và clopidogrel

Khi kê đơn esomeprazol cho điều trị theo yêu cầu, các tình trạng tương tác với các thuốc khác, do nồng độ trong huyết tương của esomeprazol dao động nên được xem xét.

Tương tác với các xét nghiệm

Nồng độ Chromogranin A (CgA) tăng có thể ảnh hưởng đến các đánh giá khối u thần kinh nội tiết. Để tránh bị ảnh hưởng, nên ngừng điều trị bằng esomeprazol ít nhất năm ngày trước khi đo nồng độ CgA. Nếu nồng độ CgA và nồng độ hóc môn gastrin không ở trong phạm vi tham chiếu sau khi đo ban đầu, thì nên đo lại sau 14 ngày ngừng điều trị thuốc ức chế bơm proton.

Trước khi dùng thuốc ức chế bơm proton, phải loại trừ khả năng ung thư dạ dày vì thuốc có thể che lấp triệu chứng, làm chậm chẩn đoán ung thư. Thận trọng khi dùng ở người bị bệnh gan, người mang thai hoặc cho con bú. Phải thận trọng khi dùng esomeprazol kéo dài ví có thể gây viêm teo dạ dày. Phải thận trọng khi dùng cho trẻ em dưới 18 tuổi vì độ an toàn và hiệu quả chưa được xác định. Thuốc không được khuyến cáo dùng cho trẻ em.

Nang giải phóng chậm esomeprazol magnesi có chứa sucrose. Bệnh nhân có các vấn đề di truyền hiếm gặp về dung nạp fructose, kém hấp thu glucose-galactose hoặc thiếu sucrose-isomaltase không nên dùng thuốc này.

https://nhathuocngocanh.com/

Sử dụng thuốc cho phụ nữ có thai và cho con bú.

Thời kỳ mang thai: Chưa có nghiên cứu đầy đủ khi dùng esomeprazole ở phụ nữ mang thai. Đã nhận được các báo cáo lẻ tẻ về các sự khác thường bẩm sinh xảy ra ở trẻ nhỏ sinh ra từ các phụ nữ đã dùng omeprazol trong thời kỳ mang thai. Vì vậy chỉ sử dụng esomeprazol khi thật cần thiết trong thời kỳ mang thai.

Thời kỳ cho con bú: Chưa nghiên cứu sự bài tiết của esomeprazol trong sữa mẹ. Tuy vậy, đã đo nồng độ của omeprazol trong sữa của một phụ nữ sau khi uống 20mg. Vì esomeprazol có thể được bài tiết trong sữa người, vì khả năng xảy ra các tác dụng không mong muốn nghiêm trọng ở trẻ nhỏ bú sữa do esomeprazol, và vì khả năng gây u đã được chứng minh với omeprazol trong các nghiên cứu về tác dụng gây ung thư trên chuột cống trắng, sẽ phải quyết định hoặc ngừng cho con bú hoặc ngừng dùng thuốc, có cân nhắc tầm quan trọng của thuốc đối với người mẹ.

Ảnh hưởng của thuốc đến khả năng lái xe và vận hành máy móc:

Bệnh nhân cần lưu ý thuốc có thể gây đau đầu, chóng mặt và buồn ngủ.

Tương tác thuốc:

Esomeprazol được chuyển hóa một phần lớn trong gan bởi CYP2C19 và CYP3A4.

Các nghiên cứu *in vitro* và *in vivo* cho thấy esomeprazol có thể không ức chế các enzym CYP 1A2, 2A6, 2C9, 2D6, 2E1 và 3A4. Không có tương tác liên quan đến lâm sàng với các thuốc được chuyển hóa bởi enzym CPY này có thể xảy ra. Các nghiên cứu về tương tác thuốc cho thấy esomeprazol không có tương tác có ý nghĩa lâm sàng nào với phenytoin, warfarin, quinidin, clarithromycin hoặc amoxicilin. Đã nhận được các báo cáo sau khi thuốc được cấp phép lưu hành về các thay đổi của trị số đo prothrombin trong các bệnh nhân điều trị đồng thời với warfarin và esomeprazol. Sự tăng về INR và thời gian prothrombin có thể dẫn đến sự chảy máu không bình thường và thậm chí tử vong. Bệnh nhân điều trị với thuốc ức chế bơm proton và warfarin đồng thời có thể cần được theo dõi về sự tăng INR và thời gian prothrombin.

Do ức chế bài tiết acid, esomeprazol làm tăng pH dạ dày, ảnh hưởng đến sinh khả dụng của các thuốc hấp thu phụ thuộc pH: ketoconazol, muối sắt, digoxin.

Esomeprazol tương tác dược động học với các thuốc chuyển hóa bởi hệ enzym cytochrom P_{450}, isoenzym CYP2C19 ở gan. Dùng đồng thời 30 mg esomeprazol và diazepam làm giảm 45% độ thanh thải của diazepam. Việc dùng đồng thời các thuốc tránh thụ thai uống, diazepam, phenytoin hoặc quinidin có vẻ không làm thay đổi tính chất dược động học của esomeprazol.

Liệu pháp kết hợp với clarithromycin: Việc dùng đồng thời esomeprazol, clarithromycin và amoxicilin đã dẫn đến sự tăng nồng độ huyết tương của esomeprazol và 14-hydroxy-clarithromycin.

Ảnh hưởng của esomeprazol trên dược động học của các thuốc khác

Các thuốc ức chế Protease

Đã có ghi nhận omeprazol tương tác với một số thuốc ức chế protease. Tầm quan trọng về mặt lâm sàng và những cơ chế đằng sau những tương tác đã được ghi nhận này không phải luôn được biết rõ. Tình trạng tăng pH dạ dày trong quá trình điều trị với omeprazol có thể làm thay đổi sự hấp thu của các thuốc ức chế protease. Các cơ chế tương tác khác có thể xảy ra thông qua sự ức chế CYP2C19. Đối với atazanavir và nelfinavir, tình trạng giảm nồng độ thuốc trong huyết thanh đã được ghi nhận khi được dùng đồng thời với thuốc omeprazol, do vậy không khuyến cáo dùng đồng thời với các thuốc này. Dùng đồng thời omeprazol (40 mg mỗi ngày một lần) với thuốc atazanavir 300 mg/ritonavir

https://nhathuocngocanh.com/

100 mg ở những tình nguyện viên khỏe mạnh cho thấy sự giảm đáng kể ở mức phơi nhiễm với atazanavir (giảm khoảng 75% ở các chỉ số AUC, C_{max} và C_{min}). Kể cả khi tăng liều atazanavir lên tới 400 mg cũng không thể bù đắp được những tác động từ thuốc omeprazol làm giảm mức phơi nhiễm với atazanavir. Dùng đồng thời thuốc omeprazol (20 mg mỗi ngày một lần) với thuốc atazanavir 400 mg/ritonavir 100 mg ở những tình nguyện viên khỏe mạnh cho thấy sự sụt giảm khoảng 30% mức phơi nhiễm atazanavir so với mức phơi nhiễm thuốc ghi nhận được khi dùng atazanavir 300 mg/ritonavir 100 mg mỗi ngày một lần khi không dùng đồng thời với thuốc omeprazol 20 mg mỗi ngày một lần. Dùng đồng thời với omeprazol (40 mg mỗi ngày một lần) làm giảm chỉ số AUC, C_{max} và C_{min} trung bình của thuốc nelfinavir xuống 36–39 % và các giá trị AUC, C_{max} và C_{min} trung bình của chất chuyển hóa có hoạt tính dược lý M8 được ghi nhận giảm từ 75-92%. Do omeprazol và esomeprazol có các tác dụng dược lực học và đặc tính động lực học tương tự nhau, không khuyến cáo sử dụng đồng thời esomeprazol và atazanavir và chống chỉ định dùng đồng thời esomeprazol với nelfinavir.

Đối với thuốc saquinavir (khi dùng đồng thời với ritonavir), tình trạng tăng nồng độ thuốc trong huyết thanh (80-100%) đã được ghi nhận khi dùng đồng thời với omeprazol (40 mg mỗi ngày một lần). Việc điều trị với omeprazol liều 20 mg mỗi ngày một lần không gây ảnh hưởng đến mức phơi nhiễm với thuốc darunavir (khi dùng đồng thời với ritonavir) và amprenavir (khi dùng đồng thời với ritonavir). Việc điều trị với esomeprazol liều 20 mg mỗi ngày một lần cũng không gây ảnh hưởng đến mức phơi nhiễm với thuốc amprenavir (kể cả khi dùng đồng thời và không dùng đồng thời với ritonavir). Điều trị với thuốc omeprazol ở liều 40 mg mỗi ngày một lần không gây ảnh hưởng đến mức phơi nhiễm với thuốc lopinavir (khi dùng đồng thời với ritonavir).

Methotrexat:

Khi được dùng đồng thời với các thuốc ức chế bơm proton, nồng độ của methotrexat được ghi nhận tăng lên ở một số bệnh nhân. Có thể cần xem xét tạm ngưng điều trị với esomeprazol ở những trường hợp đang điều trị với methotrexat ở các mức liều cao.

Tacrolimus:

Điều trị đồng thời với esomeprazol được ghi nhận làm tăng nồng độ trong huyết thanh của tacrolimus. Cần theo dõi chặt chẽ nồng độ của tacrolimus và các chỉ số chức năng thận (độ thanh thải creatinin) cũng như điều chỉnh liều tacrolimus nếu cần thiết.

Voriconazol

Esomeprazol (40mg, 1 lần/ ngày) làm tăng 15% Cmax và 41% AUC của voriconazol (một cơ chất của CYP2C19)

Cilostazol

Omeprazol cũng như esomeprazol hoạt động như những chất ức chế CYP2C19. Omeprazol với liều 40mg được dùng cho các đối tượng khỏe mạnh trong nghiên cứu chéo, làm tăng 18% Cmax và 26% AUC của cilostazol, và tăng 29% Cmax và 69% AUC của một trong các chất chuyển hóa có hoạt tính.

Cisaprid

Ở người tình nguyện khỏe mạnh, khi dùng chung cisaprid với 40mg esomeprazol , AUC tăng lên 32% và thời gian bán thải kéo dài thêm 31% nhưng nồng độ đỉnh cisapride trong huyết tương tăng lên không đáng kể. Khoảng QTc hơi kéo dài sau khi dùng cisaprid đơn trị liệu, không bị kéo dài hơn nữa khi dùng đồng thời cisaprid với esomeprazol.

Clopidogrel

Kết quả nghiên cứu trên đối tượng khỏe mạnh cho thấy tương tác dược động học PK/ dược lực học PD giữa clopidogrel (liều khởi đầu 300mg, liều duy trì 75mg/ ngày) và esomeprazol (40mg/ngày uống hàng ngày) làm giảm trung bình 40% nồng độ và thời gian tiếp xúc với chất chuyển hóa hoạt tính của clopidrogrel và giảm trung bình 14% sự ức chế tối đa kết tập tiểu cầu (gây ra bởi ADP).

Khi clopidogrel được dùng cùng với một phối hợp liều cố định esomeprazol 20mg + ASA 81mg so với clopidogrel dùng đơn độc trong một nghiên cứu thực hiện trên các đối tượng khỏe mạnh, sự phơi nhiễm với chất chuyển hóa hoạt tính của clopidrogrel giảm gần 40%. Tuy nhiên, mức độ tối đa của sự ức chế kết tập tiểu cầu (gây ra bởi ADP) ở các đối tượng này giống nhau ở các nhóm dùng clopidogrel đơn độc và nhóm dùng clopidogrel + nhóm sản phẩm phối hợp (esomeprazol + ASA).

Các dữ liệu không nhất quán về mối liên quan trên lâm sàng của tương tác dược động/ lực học này ở khía cạnh biến cố tim mạch lớn đã được ghi nhận từ các nghiên cứu quan sát và nghiên cứu lâm sàng. Để thận trọng, không nên dùng đồng thời esomeprazol với clopidogrel.

https://nhathuocngocanh.com/

Tương kỵ:

Do không có các nghiên cứu về tính tương kỵ của thuốc, không trộn lẫn thuốc này với các thuốc khác.

Tác dụng không mong muốn (ADR):

Nhìn chung esomeprazol dung nạp tốt cả khi sử dụng thời gian ngắn hoặc thời gian dài.

Thường gặp, ADR>1/100:

Toàn thân: đau đầu, chóng mặt, ban ngoài da.

Tiêu hóa: buồn nôn, nôn, đau bụng, tiêu chảy, táo bón, đầy hơi, khô miệng.

Ít gặp 1/1000<ADR<1/100:

Toàn thân: mệt mỏi, mất ngủ, buồn ngủ, phát ban, ngứa, rối loạn thị giác.

Hiếm gặp: ADR,<1/1000:

Toàn thân: sốt, đổ mồ hôi, phù ngoại biên, mẫn cảm với ánh sáng, phản ứng quá mẫn (bao gồm mề đay, phù mạch, co thắt phế quản, sốc phản vệ).

Thần kinh trung ương: kích động, trầm cảm, lú lẫn có hồi phục, ảo giác ở người bệnh nặng.

Huyết học: chứng mất bạch cầu hạt, giảm bạch cầu, giảm tiểu cầu.

Gan: tăng enzym gan, viêm gan, vàng da, suy chức năng gan.

Tiêu hóa: rối loạn vị giác.

Cơ xương: đau khớp, đau cơ.

Tiết niệu: viêm thận kẽ.

Da: ban bọng nước, hội chứng stevens – Johnson, hoại tử biểu bì nhiễm độc, viêm da.

Do làm giảm độ acid của dạ dày, các thuốc ức chế bơm proton có thể làm tăng nguy cơ nhiễm khuẩn ở đường tiêu hóa.

Phải ngưng thuốc khi có biểu hiện tác dụng không mong muốn nặng. Thông báo ngay cho bác sỹ hoặc dược sỹ những phản ứng có hại gặp phải khi dùng thuốc.

Quá liều và xử trí:

Có một số báo cáo về quá liều với esomeprazol uống. Các liều thay đổi tới 2.400 mg (gấp 120 lần liều thường dùng lâm sàng được khuyến cáo. Các biểu hiện có thể thay đổi, nhưng gồm có lú lẫn, ngủ lơ mơ, nhìn mờ, nhịp tim nhanh, buồn nôn, toát mồ hôi, đỏ bừng, nhức đầu, miệng khô và các tác dụng không mong muốn khác giống như tác dụng nhận xét thấy trong kinh nghiệm lâm sàng bình thường. Không biết có thuốc giải độc đặc hiệu nào cho esomeprazol. Vì esomeprazol được gắn một phần lớn với protein, có thể nó không bị loại bỏ bởi sự thẩm tách. Trong trường hợp quá liều, thực hiện việc điều trị triệu chứng và hỗ trợ.

https://nhathuocngocanh.com/

Đặc tính dược lực học

Loại thuốc: Thuốc chữa loét dạ dày – tá tràng, nhóm ức chế bơm proton.

Mã ATC: A02B C05.

Esomeprazol là dạng đồng phân S của omeprazol, được dùng tương tự như omeprazol trong điều trị loét dạ dày-tá tràng và bệnh trào ngược dạ dày-thực quản. Esomeprazol là 1 base yếu, được chuyển hóa thành dạng có hoạt tính trong môi trường acid của tế bào viền ở thành dạ dày. Esomeprazol gắn với H^+/K^+-ATPase (còn gọi là bơm proton) ở tế bào viền ở thành dạ dày, ức chế đặc hiệu hệ thống enzym này, ngăn cản bước cuối cùng của sự bài tiết acid vào lòng dạ dày. Vì vậy esomeprazol có tác dụng ức chế dạ dày tiết acid cơ bản và cả khi bị kích thích do bất kỳ tác nhân nào.

Đặc tính dược động học:

Esomeprazol hấp thu nhanh sau khi uống, đạt nồng độ cao nhất trong huyết tương sau 1-2 giờ. Sinh khả dụng của esomeprazol tăng lên theo liều dùng và khi dùng nhắc lại, đạt khoảng 68% khi dùng liều 20mg và 98% khi dùng liều 40mg. Thức ăn làm chậm và giảm hấp thu esomeprazol, diện tích dưới đường cong (AUC) sau khi uống 1 liều duy nhất esomeprazol 40mg vào bữa ăn so với lúc đói giảm từ 33% đến 35%. Do đó esomeprazol phải uống ít nhất một giờ trước bữa ăn. Esomeprazol gắn với tỷ lệ 97% với protein huyết tương. Sự gắn với protein huyết tương không thay đổi trên phạm vi nồng độ 2-20 mol/lít. Thể tích phân bố khi nồng độ thuốc ổn định ở người tình nguyện khỏe mạnh là 16 lít. Thuốc chuyển hóa chủ yếu ở gan nhờ isoenzym CYP2C19, hệ enzym cytochrom P_{450} thành các chất chuyển hóa hydroxyl và desmethyl không còn hoạt tính. Phần còn lại được chuyển hóa qua isoenzym CYP3A4 thành esomeprazol sulfon. Khi dùng nhắc lại, chuyển hóa bước đầu qua gan và độ thanh thải của thuốc giảm, có thể do isoenzym CYP2C19 bị ức chế. Tuy nhiên không có hiện tượng tích lũy thuốc khi dùng mỗi ngày một lần. Ở một số người vì thiếu CPY2C19 do di truyền (15-20% người châu Á), nên làm chậm chuyển hóa esomeprazol, dẫn đến giá trị AUC tăng cao khoảng 2 lần so với người có đủ enzym. Nửa đời thải trừ trong trong huyết tương 1-1,5 giờ. Khoảng 80% liều uống được thải trừ dưới dạng các chất chuyển hóa không có hoạt tính trong nước tiểu, phần còn lại được thải trừ trong phân. Dưới 1% chất mẹ được thải trừ trong nước tiểu. Ở người suy gan nặng, giá trị AUC ở trạng thái ổn định cao hơn 2-3 lần so với người có chức năng gan bình thường, vì vậy phải giảm liều esomeprazol ở những người bệnh này, liều dùng không quá 20mg một ngày.

Dược động học ở những nhóm bệnh nhân đặc biệt:

Người chuyển hóa kém

Khoảng 2.9 ± 1.5% bệnh nhân không có men chức năng CYP2C19 và được gọi là nhóm người chuyển hóa kém. Ở các cá nhân này, sự chuyển hóa esomeprazol có thể được xúc tác chủ yếu bởi CYP3A4. Sau khi dùng liều lặp lại esomeprazol 40mg,1 lần/ngày, Nồng độ và thời gian tiếp xúc (AUC) trung bình ở người chuyển hóa kém cao hơn 100% so với bệnh nhân có men chức năng CYP2C19 (nhóm người chuyển hóa mạnh). Nồng độ đỉnh trung bình trong huyết tương tăng khoảng 60%. Những ghi nhận này không ảnh hưởng liều dùng esomeprazol.

Giới tính

Sau khi dùng liều đơn esomeprazol 40mg, AUC trung bình ở phụ nữ cao hơn nam giới khoảng 30%. Không ghi nhận có sự khác biệt về AUC ở nam và nữ sau khi dùng liều lặp lại 1 lần/ngày. Những ghi nhận này không ảnh hưởng liều dùng esomeprazol.

Bệnh nhân suy gan

Sự chuyển hóa của esomeprazol có thể bị suy giảm ở bệnh nhân rối loạn chức năng gan từ nhẹ đến trung bình. Tốc độ chuyển hóa giảm ở bệnh nhân rối loạn chức năng gan nặng, dẫn đến làm tăng gấp đôi AUC của esomeprazol. Vì vậy, không dùng quá liều tối đa 20mg ở bệnh nhân rối loạn chức năng gan nặng. Esomeprazol hoặc các chất chuyển hóa chính không có khuynh hướng tích lũy khi dùng 1 lần/ ngày.

Bệnh nhân suy thận

Chưa có nghiên cứu nào được thực hiện trên bệnh nhân suy giảm chức năng thận. Vì thận chịu trách nhiệm trong việc bài tiết các chất chuyển hóa của esomeprazol nhưng không chịu trách nhiệm cho sự đào thải thuốc dưới dạng không đổi, người ta cho là sự chuyển hóa của esomeprazol không thay đổi ở bệnh nhân suy giảm chức năng thận.

Người cao tuổi

Sự huyển hóa của esomeprazol không thay đổi đáng kể ở bệnh nhân cao tuổi (71-80 tuổi)

https://nhathuocngocanh.com/

Trẻ em

Trẻ vị thành niên 12-18 tuổi

Sau khi sử dụng liều lặp lại 20 mg và 40 mg esomeprazol ở trẻ vị thành niên 12-18 tuổi, tổng nồng độ và thời gian tiếp xúc (AUC) và thời gian đạt nồng độ tối đa trong huyết tương (tmax) tương tự như ở người lớn.

Quy cách đóng gói: Hộp carton đựng 1 lọ x 30 viên nang.

Điều kiện bảo quản: Bảo quản dưới 30°C, tránh ẩm. **Để thuốc ngoài tầm tay trẻ em.**

Hạn dùng: 24 tháng kể từ ngày sản xuất. Không dùng thuốc đã hết hạn sử dụng ghi trên bao bì.

Tiêu chuẩn chất lượng: Tiêu chuẩn cơ sở sản xuất.

Tên và địa chỉ cơ sở sản xuất: Hetero Labs Limited,

Địa chỉ: Unit-III, 22 – 110, I.D.A, Jeedimetla, Hyderabad, Telangana, Ấn-độ.