

R_x Thuốc này chỉ dùng theo đơn thuốc

ESOMEPRAZOL 40 - HV

Viên nang cứng esomeprazol 40 mg

Để xa tầm tay trẻ em

Đọc kỹ hướng dẫn sử dụng trước khi dùng

Thành phần

Mỗi viên nang cứng chứa:

Hoạt chất: Esomeprazol (dưới dạng vi hạt esomeprazol magnesium dihydrat bao tan trong ruột) 40 mg
(* Thành phần vi hạt esomeprazol magnesium dihydrat bao tan trong ruột gồm: Esomeprazol magnesium dihydrat, Hypromellose (HPMC E5), Mannitol, Sucrose, Crospovidone, HPMC phthalate, Diethyl phthalate)

Dạng bào chế: Viên nang cứng chứa vi hạt bao tan trong ruột.

Phân loại: ESOMEPRAZOL 40-HV là thuốc kháng tiết acid dạ dày, thuộc nhóm thuốc chống loét dạ dày – ruột theo cơ chế ức chế bơm proton.

Đặc tính dược lực học và cơ chế tác dụng

ESOMEPRAZOL 40-HV chứa esomeprazol là dạng đồng phân S của omeprazol, được dùng tương tự như omeprazol trong điều trị loét dạ dày – tá tràng, bệnh trào ngược dạ dày - thực quản và hội chứng Zollinger – Ellison. Esomeprazol gắn với H⁺/K⁺-ATPase (còn gọi là bơm proton) ở tế bào thành của dạ dày, làm bất hoạt hệ thống enzym này, ngăn cản bước cuối cùng của sự bài tiết acid hydroclorid vào lòng dạ dày. Vì vậy esomeprazol có tác dụng ức chế dạ dày tiết lượng acid cơ bản và cả khi bị kích thích do bất kỳ tác nhân nào. Thuốc tác dụng mạnh, kéo dài.

Các thuốc ức chế bơm proton có tác dụng ức chế nhưng không diệt trừ được *Helicobacter pylori*, nên phải phối hợp với các kháng sinh (như amoxicilin, tetracyclin và clarithromycin) mới có thể diệt trừ có hiệu quả vi khuẩn này.

Trong hai nghiên cứu so sánh hoạt tính với ranitidin, esomeprazol cho thấy tác dụng tốt trong chữa bệnh loét dạ dày ở những bệnh nhân sử dụng NSAIDs, bao gồm cả NSAIDs có chọn lọc trên COX-2.

Trong hai nghiên cứu với giả dược, esomeprazol cho thấy tác dụng tốt trong việc phòng chống viêm loét dạ dày và tá tràng ở bệnh nhân sử dụng NSAIDs (trên 60 tuổi và/hoặc có tiền sử loét), bao gồm cả NSAIDs có chọn lọc trên COX-2.

Đặc tính dược động học

Hấp thu: Esomeprazol được hấp thu nhanh sau khi uống, nồng độ đỉnh trong huyết tương đạt được 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 20 mg và 89% khi dùng liều 40 mg. Thức ăn làm chậm và giảm sự hấp thu, diện tích dưới đường cong (AUC) sau khi uống 1 liều duy nhất 40 mg vào bữa ăn so với lúc đói giảm từ 43% – 53%. Vì vậy uống esomeprazol 1 giờ trước bữa ăn.

Phân bố: Khoảng 97% esomeprazol gắn kết với protein huyết tương.

Chuyển hóa: Esomeprazol được chuyển hóa rộng rãi ở gan nhờ hệ thống cytochrome P450 isoenzym CYP2C19 thành các dẫn chất hydroxy và desmethyl không hoạt tính. Phần còn lại 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 khi dùng ngày 1 lần. Ở một số người châu Á (15-20%) vì thiếu isoenzym CYP2C19 do di truyền nên làm chậm sự chuyển hóa esomeprazol, dẫn đến AUC tăng lên 2 lần so với người có đủ enzym.

Thải trừ: Thời gian bán thải của esomeprazol khoảng 1,3 giờ, khoảng 80% liều uống thải trừ dưới dạng các chất chuyển hóa không hoạt tính trong nước tiểu, phần còn lại thải trừ qua phân. Dưới 1% chất mẹ được thải trừ trong nước tiểu.

Bệnh nhân suy gan: Ở người suy gan nặng, giá trị AUC ở tình trạng ổn định cao hơn 2-3 lần so với người có chức năng gan bình thường, nên phải giảm liều cho các đối tượng này và không nên dùng quá 20 mg mỗi ngày.

Bệnh nhân suy thận: Chưa có nghiên cứu được thực hiện ở những bệnh nhân suy thận. Do thận chịu trách nhiệm cho sự bài tiết các chất chuyển hóa của esomeprazol nhưng không chịu trách nhiệm cho việc loại bỏ chất mẹ nên sự chuyển hóa của esomeprazol dự kiến sẽ không thay đổi ở bệnh nhân suy thận.

Người cao tuổi: Chuyển hóa của esomeprazol không thay đổi đáng kể ở người cao tuổi (71-80 tuổi).

Trẻ em (12-18 tuổi): Sau khi tiêm liều lặp lại 20 mg và 40 mg esomeprazol, tổng AUC và thời gian để đạt nồng độ thuốc trong huyết tương tối đa (tmax) đối với trẻ từ 12-18 tuổi là tương tự như ở người lớn, tương ứng với cả hai liều esomeprazol.

Dược động học ở người dưới 18 tuổi chưa được nghiên cứu.

Chỉ định

ESOMEPRAZOL 40-HV được chỉ định trong những trường hợp:

- Hội chứng trào ngược dạ dày – thực quản.
- Bệnh loét dạ dày – tá tràng.
- Phối hợp với các thuốc kháng sinh phù hợp khác để điều trị hoặc dự phòng tái phát loét dạ dày, tá tràng gây ra do *Helicobacter pylori*.
- Phòng ngừa và điều trị loét dạ dày – tá tràng gây ra do thuốc kháng viêm không steroid.
- Tăng tiết acid dạ dày, bao gồm hội chứng Zollinger-Ellison.

Chống chỉ định:

Mẫn cảm với esomeprazol, các benimidazol hoặc bất kỳ thành phần nào của thuốc.

Không phối hợp với nelfinavir, atazanavir.

Liều lượng và cách dùng

Liều dùng và thời gian dùng thuốc cho từng trường hợp cụ thể theo chỉ định của bác sĩ điều trị.

Liều dùng thông thường như sau:

Hội chứng trào ngược dạ dày – thực quản: Liều khởi đầu khuyên dùng trong điều trị bệnh trào ngược dạ dày – thực quản là từ 20 đến 40 mg mỗi ngày, có thể kéo dài trên 4-8 tuần đối với những bệnh nhân không lành bệnh sau 4-8 tuần điều trị.

Trong trường hợp duy trì hay bệnh không có triệu chứng xói mòn thực quản, có thể dùng liều 20 mg mỗi ngày.

Bệnh loét dạ dày – tá tràng có *Helicobacter pylori*: Trong liệu pháp bộ ba kết hợp với amoxicillin và clarithromycin, liều thường dùng là 20 mg esomeprazol x 2 lần/ ngày trong 7 ngày hoặc esomeprazol 40 mg x 1 lần /ngày trong 10 ngày.

Bệnh loét dạ dày – tá tràng do thuốc kháng viêm không steroid: Liều yêu cầu là 20 mg hoặc 40 mg x 1 lần /ngày trong 6 tháng.

Bệnh nhân tăng tiết acid dạ dày, bao gồm hội chứng Zollinger-Ellison: Liều ban đầu được khuyến cáo là 40 mg esomeprazol x 2 lần/ngày. Sau đó liều lượng nên được điều chỉnh theo cơ địa của từng bệnh nhân và tiếp tục điều trị theo chỉ định lâm sàng. Dựa trên các dữ liệu lâm sàng đã được nghiên cứu, đa số bệnh nhân có thể được kiểm soát triệu chứng bệnh ở mức liều từ 80-160 mg esomeprazol hàng ngày. Với liều trên 80 mg mỗi ngày, liều dùng nên được chia làm 2 lần/ ngày.

Bệnh nhân suy thận: Không cần điều chỉnh liều đối với bệnh nhân suy thận nhẹ và vừa. Do kinh nghiệm điều trị ở bệnh nhân suy thận nặng còn hạn chế, nên cần thận trọng theo dõi trên đối tượng này (*xem phần dược động học ở bệnh nhân suy thận*).

Bệnh nhân suy gan: Không cần điều chỉnh liều đối với bệnh nhân suy gan nhẹ và vừa. Liều esomeprazol cho bệnh nhân suy gan nặng không quá 20 mg/ngày.

Người cao tuổi: Không cần điều chỉnh liều đối với người cao tuổi.

Trẻ em trên 12 tuổi: Điều trị hội chứng trào ngược dạ dày – thực quản: 40 mg esomeprazol x 1 lần/ngày, trong 4 tuần. Liệu trình điều trị thêm 4 tuần nữa được khuyến cáo cho các bệnh nhân viêm thực quản chưa được chữa lành hoặc những bệnh nhân có triệu chứng kéo dài dai dẳng.

Trẻ em dưới 12 tuổi: Esomeprazol không nên được sử dụng ở trẻ em dưới 12 tuổi do không có dữ liệu lâm sàng.

Cách dùng
Uống nguyên viên thuốc, không được nhai hay nghiền các vi hạt. Uống trước bữa ăn (tốt nhất là trước bữa ăn sáng).

Cảnh báo và thận trọng
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.
Dùng esomeprazol kéo dài có thể gây viêm teo dạ dày hoặc tăng nguy cơ nhiễm khuẩn (như viêm phổi mắc phải tại cộng đồng).
Có thể tăng nguy cơ tiêu chảy do *Clostridium difficile* khi dùng các thuốc ức chế bơm proton.
Khi dùng các thuốc ức chế bơm proton, đặc biệt khi dùng liều cao và kéo dài (trên 1 năm), có thể làm tăng nguy cơ gãy xương chậu, xương cổ tay hoặc cột sống do loãng xương. Cơ chế của hiện tượng này chưa được giải thích, nhưng có thể do giảm hấp thu calci không hòa tan do tăng pH dạ dày. Khuyến cáo dùng liều thấp nhất có tác dụng trong thời gian ngắn nhất có thể, phù hợp với tình trạng lâm sàng. Những bệnh nhân có nguy cơ gãy xương do loãng xương nên dùng đủ calci và vitamin D, đánh giá tình trạng xương và quản lý theo hướng dẫn.
Hạ maginesi huyết (có hoặc không có triệu chứng) hiếm khi gặp ở người bệnh dùng thuốc ức chế bơm proton kéo dài (ít nhất 3 tháng hoặc trong hầu hết các trường hợp dùng kéo dài trên 1 năm). Do thành phần vi hạt có chứa sucrose nên các bệnh nhân với các bệnh lý di truyền hiếm gặp về dung nạp galactose, hoặc thu kém hấp thu glucose-galactose không nên dùng thuốc này.
Thận trọng khi sử dụng cho bệnh nhân bị bệnh tiểu đường.

Sử dụng thuốc cho phụ nữ có thai và cho con bú
Thuốc không gây ảnh hưởng trên sự phát triển của bào thai ở người và động vật, tuy nhiên chỉ nên dùng thuốc cho phụ nữ mang thai khi thật cần thiết. Không nên dùng thuốc cho phụ nữ trong thời kỳ cho con bú. Trong trường hợp cần dùng thuốc thì phải ngưng cho con bú.

Ảnh hưởng của thuốc lên khả năng lái xe và vận hành máy móc
Một số trường hợp xảy ra tình trạng chóng mặt, nhức đầu, choáng váng khi sử dụng esomeprazol, do đó nên thận trọng dùng thuốc trong khi đang lái xe hay vận hành máy móc.

Tác dụng không mong muốn (ADR)
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, dị cảm.
Rối loạn thị giác.
Hiếm gặp, ADR < 1/1000
Toàn thân: Sốt, toát mồ hôi, phù ngoại biên, mẫn cảm với ánh sáng, rụng tóc, phản ứng quá mẫn (bao gồm mày đay, phù mạch, co thắt phế quản, sốc phản vệ).
Thần kinh trung ương: Kích động, trầm cảm, lú lẫn, ảo giác.
Hô hấp: Nhiễm khuẩn hô hấp.
Huyết học: Giảm toàn thể huyết cầu, tăng bạch cầu, giảm bạch cầu, giảm tiểu cầu.
Gan: Tăng enzym gan, viêm gan, vàng da, suy chức năng gan.
Tiêu hóa: Rối loạn vị giác, viêm miệng.
Chuyển hóa: Hạ maginesi huyết, hạ natri huyết, rối loạn chuyển hóa porphyrin.
Cơ xương: Đau khớp, đau cơ, loãng xương, gãy xương.
Tiết niệu: Viêm thận kẽ.
Nội tiết: Chứng vú to ở nam.
Da: Ban bóng 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.

Hướng dẫn cách xử trí ADR:
Phải ngừng thuốc khi có biểu hiện ADR nặng.
Thông báo cho bác sĩ những tác dụng không mong muốn gặp phải khi sử dụng thuốc.

Tương tác thuốc
-Esomeprazol ức chế sự tiết acid, làm tăng pH dạ dày, vì vậy thuốc có thể ảnh hưởng đến sinh khả dụng của một số thuốc hấp thu phụ thuộc pH như: ketoconazol, digoxin, muối sắt.
-Dùng đồng thời esomeprazol, clarithromycin và amoxicillin làm tăng nồng độ esomeprazol và 14-hydroxylarithromycin trong máu.
-Esomeprazol tương tác dược động học với các thuốc chuyển hóa bởi hệ enzym cytochrom P450 isoenzym CYP2C19 ở gan.
-Dùng đồng thời 30 mg esomeprazol và diazepam làm giảm 45% độ thanh thải của diazepam.
-Esomeprazol có thể làm tăng nồng độ trong máu của saquinavir và làm giảm nồng độ của nelfinavir và atazanavir thông qua một cơ chế chưa được xác định rõ ràng. Do đó nên xem xét việc giảm liều saquinavir khi dùng chung với esomeprazol để tránh các tác dụng không mong muốn có thể xảy ra của saquinavir.
-Esomeprazol làm giảm hoạt động của các enzym chuyển hóa clopidogrel thành dạng có hoạt tính, do đó làm giảm hoạt tính của clopidogrel, vì vậy khuyến cáo chỉ sử dụng kết hợp hai loại thuốc này khi thật cần thiết.
-Esomeprazol làm tăng nồng độ của cilostazol và các chất chuyển hóa của nó. Liều cilostazol nên được giảm từ 100 mg hai lần mỗi ngày thành 50 mg hai lần mỗi ngày khi được dùng chung với esomeprazol.

Quá liều và cách xử trí
Chưa có báo cáo về quá liều esomeprazol ở người. Hiện chưa có thuốc giải độc đặc hiệu, trong trường hợp quá liều nên điều trị triệu chứng và dùng các biện pháp hỗ trợ tổng quát. Thẩm tách máu không có tác dụng loại trừ thuốc.

Tiêu chuẩn: Tiêu chuẩn cơ sở.

Hạn dùng: 36 tháng kể từ ngày sản xuất.

Bảo quản: Bảo quản thuốc ở nơi khô thoáng, nhiệt độ dưới 30°C, tránh ánh sáng.

Nhà sản xuất:
CÔNG TY CP US PHARMA USA
Địa chỉ : Lô B1- 10, Đường D2, KCN Tây Bắc Củ Chi, TP.Hồ Chí Minh
Mọi thắc mắc và thông tin chi tiết, xin liên hệ về số điện thoại 028 37908860 – 028 37908861, **Fax:** 028 37908856