

**Rx**

**OMCAPRAZ-O**

- Thuốc này chỉ dùng theo đơn thuốc
- Để xa tầm tay trẻ em.
- Đọc kỹ hướng dẫn sử dụng trước khi dùng.

**1. Thành phần công thức thuốc:**

Mỗi lọ chứa

*Thành phần hoạt chất:* Omeprazole (dưới dạng omeprazole sodium) 40 mg

*Thành phần tá dược:* sodium carbonate, mannitol (pyrogen free), sodium hydroxide, water for injection\*.

\* dung môi bay hơi trong quá trình sản xuất

**2. Dạng bào chế:** Bột đông khô pha tiêm

**Mô tả:** Bánh bột màu trắng hoặc vàng nhẹ.

**3. Chỉ định:**

Thuốc được chỉ định như một liệu pháp thay thế đường uống trong các chỉ định sau:

*Người lớn*

- Điều trị loét tá tràng.
- Phòng ngừa tái phát loét tá tràng.
- Điều trị loét dạ dày
- Phòng ngừa tái phát loét dạ dày.
- Kết hợp với thuốc kháng sinh thích hợp, loại trừ *Helicobacter pylori* (*H. pylori*) gây bệnh loét dạ dày.
- Điều trị loét dạ dày và tá tràng do NSAID.
- Ngăn ngừa loét dạ dày và tá tràng do NSAID ở những bệnh nhân có nguy cơ.
- Điều trị chứng viêm thực quản trào ngược.
- Kiểm soát lâu dài ở bệnh nhân đã chữa lành bệnh viêm thực quản trào ngược.
- Điều trị triệu chứng bệnh trào ngược dạ dày thực quản.
- Điều trị hội chứng Zollinger-Ellison.

**4. Cách dùng, liều dùng:**

*Thay thế liệu pháp đường uống*

Ở những bệnh nhân không uống được thuốc, nên dùng omeprazole đường tĩnh mạch 40 mg x 1 lần/ngày. Ở bệnh nhân với hội chứng Zollinger-Ellison, liều khởi đầu khuyến cáo là 60 mg/ngày. Có thể dùng liều cao hơn tùy từng bệnh nhân. Nếu dùng liều cao hơn 60 mg/ngày thì chia ra 2 lần mỗi ngày.

Omeprazole được truyền tĩnh mạch trong 20 - 30 phút.

Bệnh nhân đặc biệt



#### *Bệnh nhân suy thận*

Không cần điều chỉnh liều ở bệnh nhân suy giảm chức năng thận.

#### *Bệnh nhân suy gan*

Ở bệnh nhân suy giảm chức năng gan, có thể dùng liều hàng ngày 10-20 mg.

#### *Người cao tuổi (> 65 tuổi)*

Không cần hiệu chỉnh liều ở người cao tuổi.

#### *Trẻ em*

Kinh nghiệm sử dụng omeprazole đường tĩnh mạch ở trẻ em còn hạn chế.

#### *Đường dùng*

Omeprazole được truyền tĩnh mạch trong 20 - 30 phút.

Sau khi pha, dung dịch không màu, trong suốt, không chứa các hạt nhìn thấy được.

### **5. Chống chỉ định:**

Đã biết quá mẫn với omeprazole.

Giống như các thuốc ức chế bơm proton (PPI) khác, không nên sử dụng omeprazole đồng thời với nelfinavir.

### **6. Cảnh báo và thận trọng khi dùng thuốc:**

Khi bệnh loét dạ dày được xác định hoặc nghi ngờ và kèm với sự hiện diện của một hoặc nhiều triệu chứng cảnh báo sau đây: sụt cân đáng kể không chủ đích, nôn mửa tái phát, khó nuốt, nôn ra máu hoặc đại tiện ra máu đen nên loại trừ khả năng ác tính vì việc điều trị có thể che lấp triệu chứng và làm chậm trễ việc chẩn đoán.

Không khuyến cáo sử dụng kèm atazanavir với các thuốc ức chế bơm proton. Trong trường hợp việc phối hợp atazanavir và thuốc ức chế bơm proton là không thể tránh được nên theo dõi chặt chẽ trên lâm sàng khi tăng liều atazanavir đến 400mg kết hợp với ritonavir 100mg; không nên vượt quá liều 20mg omeprazole.

Omeprazole, cũng như các thuốc ức chế tiết acid khác, có thể giảm hấp thu vitamin B12 (cyanocobalamin) do giảm hoặc thiếu axít dịch vị. Điều này nên được cân nhắc ở những bệnh nhân giảm dự trữ hoặc có nguy cơ giảm hấp thu vitamin B12 khi điều trị dài hạn.

Omeprazole là một chất ức chế CYP2C19. Khi bắt đầu hoặc kết thúc điều trị với omeprazole nên cân nhắc đến các tương tác tiềm tàng với các thuốc chuyển hóa qua CYP2C19. Đã có ghi nhận tương tác giữa clopidogrel và omeprazole. Chưa rõ mối tương quan lâm sàng của tương tác này. Nhằm mục đích thận trọng, không nên dùng đồng thời omeprazole và clopidogrel.

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

Giảm maggesi huyết nghiêm trọng đã được báo cáo ở những bệnh nhân điều trị bằng các thuốc ức chế bơm proton như omeprazole trong ít nhất ba tháng, và trong đa số các trường hợp là 1 năm. Các triệu chứng nghiêm trọng của hạ maggesi huyết như là mệt mỏi, co cứng cơ, mê sảng, co giật, choáng váng, và loạn nhịp thất có thể xảy ra, nhưng các biểu hiện này có thể khởi phát

âm thầm và không được lưu tâm. Trong đa số các trường hợp, tình trạng hạ maggesi huyết có thể được cải thiện khi được bổ sung maggesi và ngừng PPI.

Đối với những bệnh nhân cần được điều trị dài hạn hoặc những bệnh nhân dùng kèm PPI với digoxin hoặc các thuốc có thể gây hạ maggesi huyết (như thuốc lợi tiểu), các chuyên viên y tế nên xem xét đo nồng độ maggesi huyết trước khi bắt đầu điều trị PPI và định kỳ trong quá trình điều trị.

Thuốc ức chế bơm proton, đặc biệt khi sử dụng liều cao và trong thời gian dài (>1 năm), có thể gây tăng nhẹ nguy cơ gãy xương hông, xương cổ tay và xương sống, đặc biệt là người cao tuổi hoặc những người có các yếu tố nguy cơ đã biết. Các nghiên cứu quan sát chỉ ra rằng các thuốc ức chế bơm proton có thể làm tăng tổng thể nguy cơ gãy xương khoảng 10-40%. Một phần trong mức tăng này có thể do các yếu tố nguy cơ khác. Các bệnh nhân có nguy cơ loãng xương nên được chăm sóc theo các hướng dẫn lâm sàng hiện hành và nên được dùng một lượng vừa đủ vitamin D và calci.

#### *Suy thận*

Viêm ống thận kẽ cấp tính (TIN) đã được quan sát thấy ở những bệnh nhân dùng omeprazole và có thể xảy ra ở bất kỳ thời điểm nào trong quá trình điều trị bằng omeprazole. Viêm ống thận kẽ cấp tính có thể tiến triển thành suy thận.

Nên ngừng dùng omeprazole trong trường hợp nghi ngờ TIN và nên bắt đầu điều trị thích hợp ngay lập tức.

#### *Lupus ban đỏ hệ thống (SCLÉ)*

Các PPI rất hiếm gây ra các trường hợp lupus ban đỏ hệ thống. Nếu xuất hiện tổn thương, đặc biệt ở những vùng da hở, và nếu đi cùng với chứng đau khớp bệnh nhân cần phải chăm sóc y tế, nhân viên y tế nên khuyến cáo ngừng sử dụng omeprazole. Khi lupus ban đỏ hệ thống đã điều trị với PPI trước đó thì nguy cơ sẽ cao hơn khi sử dụng PPI khác.

#### *Ảnh hưởng đến các xét nghiệm*

Nồng độ Chromogranin A (CgA) tăng lên có thể can thiệp vào việc dò tìm các khối u thần kinh nội tiết. Nhằm tránh sự can thiệp này, nên ngưng điều trị bằng omeprazole ít nhất 5 ngày trước khi tiến hành đo CgA (xem Đặc tính dược lực học).

Khi nghi ngờ bệnh loét, phải kiểm tra lại một cách khách quan ở giai đoạn sớm bằng X quang hoặc nội soi để tránh việc điều trị không thích hợp.

Khi bệnh loét dạ dày được xác định hoặc nghi ngờ hoặc kèm với sự hiện diện của bất kỳ triệu chứng cảnh báo nào như: sụt cân đáng kể không chủ đích, nôn mửa tái phát, khó nuốt, nôn ra máu hoặc đại tiện ra máu đen nên loại trừ khả năng ác tính vì việc điều trị có thể che lấp triệu chứng và chậm trễ việc chẩn đoán.

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

##### ***Sử dụng thuốc cho phụ nữ có thai:***



Các nghiên cứu dịch tễ học được tiến hành tốt cho thấy omeprazole không gây phản ứng ngoại ý trên phụ nữ có thai hoặc sức khỏe bào thai/trẻ mới sinh. Omeprazole có thể sử dụng trong thời gian mang thai, tuy nhiên nên thận trọng ở phụ nữ có thai.

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

Omeprazole tiết qua sữa mẹ nhưng không có ảnh hưởng tới trẻ khi sử dụng liều điều trị.

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

Thuốc không ảnh hưởng lên khả năng lái xe hoặc vận hành máy. Các tác dụng không mong muốn như mệt mỏi và rối loạn tầm nhìn có thể xảy ra. Nếu bị ảnh hưởng, bệnh nhân không nên lái xe hoặc vận hành máy móc.

**9 Tương tác, tương kỵ của thuốc:**

***Tác động của omeprazol lên dược động học của các thuốc khác***

***Các thuốc hấp thu phụ thuộc pH:***

Việc giảm độ acid dịch vị trong quá trình điều trị với omeprazole có thể làm tăng hoặc giảm sự hấp thu các thuốc hấp thu phụ thuộc pH dạ dày.

***Nelfinavir, atazanavir***

Nồng độ trong huyết tương của nelfinavir và atazanavir giảm khi dùng đồng thời với omeprazol. Chống chỉ định dùng đồng thời omeprazole và nelfinavir.

Dùng đồng thời omeprazole (40mg/1 lần/ngày) làm giảm mức tiếp xúc nelfinavir trung bình khoảng 40% và mức tiếp xúc trung bình với chất chuyển hóa có hoạt tính dược lý M8 giảm khoảng 75-90%. Tương tác này có thể liên quan tới ức chế CYP2C19.

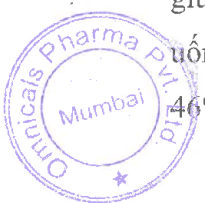
Việc dùng đồng thời omeprazole và atazanavir không được khuyến cáo. Dùng đồng thời omeprazole (40mg/1 lần/ngày) và atazanavir 300mg/ritonavir 100mg trên người tình nguyện khỏe mạnh dẫn tới giảm khoảng 75% mức tiếp xúc atazanavir. Tăng liều atazanavir lên 40mg không bù trừ được tác động của omeprazole lên mức tiếp xúc atazanavir. Dùng đồng thời omeprazole (20mg 1 lần mỗi ngày) với atazanavir 400mg/ritonavir 100mg cho người tình nguyện khỏe mạnh làm giảm khoảng 30% mức tiếp xúc atazanavir so với atazanavir 300mg/ritonavir 100mg một lần mỗi ngày.

***Digoxin***

Điều trị đồng thời omeprazole (20mg/ngày) và digoxin trên đối tượng khỏe mạnh làm tăng sinh khả dụng của digoxin lên 10%. Ngộ độc digoxin hiếm khi được báo cáo. Tuy nhiên, nên thận trọng khi dùng liều cao omeprazole ở bệnh nhân cao tuổi. Theo dõi hiệu quả điều trị digoxin nên được tăng cường.

***Clopidogrel***

Kết quả từ các nghiên cứu trên đối tượng khỏe mạnh đã chỉ ra tương tác dược động/dược lực giữa clopidogrel (liều nạp 300mg/liều duy trì 75mg/ngày) và omeprazole (80mg/ngày đường uống) dẫn đến giảm mức tiếp xúc của chất chuyển hóa có hoạt tính của clopidogrel trung bình 46% và giảm sự ức chế tối đa kết tập tiểu cầu (gây bởi ADP) trung bình 16%.



Dữ liệu không nhất quán trong các công bố lâm sàng về tương tác dược động/dược lực của omeprazole về các biến cố tim mạch chính đã được báo cáo trong cả các nghiên cứu quan sát và nghiên cứu lâm sàng. Nhằm mục đích thận trọng, không nên sử dụng đồng thời omeprazol và clopidogrel.

#### *Các thuốc khác*

Sự hấp thu posaconazol, erlotinib, ketoconazol và itraconazol bị giảm nghiêm trọng và do đó hiệu quả lâm sàng cũng có thể bị ảnh hưởng. Đối với posaconazol và erlotinib nên tránh dùng đồng thời với omeprazole.

#### Các thuốc chuyển hóa qua CYP2C19:

Omeprazole là một chất ức chế CYP2C19 trung bình, một enzym chuyển hóa chính của omeprazole. Do đó, sự chuyển hóa các thuốc dùng kèm cũng chuyển hóa qua CYP2C19 có thể bị giảm xuống và dẫn đến tăng mức tiếp xúc toàn thân với các thuốc này. Ví dụ về các thuốc chuyển hóa qua CYP2C19 là R-warfarin và các thuốc kháng vitamin K khác, cilostazol, diazepam và phenytoin.

#### *Cilostazol*

Trong một nghiên cứu chéo, omeprazole với liều 40mg dùng trên đối tượng khỏe mạnh làm tăng Cmax và AUC của cilostazol lên tương ứng 18% và 26%, và của các chất chuyển hóa có hoạt tính của nó tương ứng là 29% và 69%.

#### *Phenytoin*

Nên theo dõi nồng độ phenytoin trong huyết tương trong 2 tuần đầu điều trị bằng omeprazole và nếu cần phải điều chỉnh liều phenytoin, có thể cần phải theo dõi và điều chỉnh liều khi ngừng điều trị bằng omeprazole.

#### Chưa rõ cơ chế:

#### *Saquinavir*

Dùng đồng thời omeprazole và saquinavir/ritonavir dẫn đến tăng nồng độ saquinavir trong huyết tương lên khoảng 70%, liên quan đến sự dung nạp tốt ở bệnh nhân nhiễm HIV.

#### *Tacrolimus*

Đã có báo cáo về tăng nồng độ tacrolimus trong huyết thanh khi dùng đồng thời với omeprazole. Cần tăng cường theo dõi nồng độ tacrolimus cũng như là chức năng thận (độ thanh thải creatinin) và điều chỉnh liều tacrolimus nếu cần.

#### *Methotrexat*

Khi dùng đồng thời với các thuốc ức chế bơm proton, nồng độ methotrexat tăng lên đã được báo cáo ở một số bệnh nhân. Ở bệnh nhân dùng liều cao methotrexat, tạm dừng omeprazole có thể cần được tính đến.

#### **Tác động của các thuốc khác lên dược động học của omeprazol:**

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



Do omeprazole được chuyển hóa bởi CYP2C19 và CYP3A4, các thuốc được biết đến ức chế CYP2C19 hoặc CYP3A4 (như clarithromycin và voriconazol) có thể dẫn tới tăng nồng độ huyết thanh omeprazole do làm giảm mức độ chuyển hóa của omeprazole. Dùng kèm voriconazol dẫn tới tăng hơn gấp đôi mức tiếp xúc của omeprazole. Trong trường hợp dung nạp tốt liều cao omeprazole, điều chỉnh liều omeprazole thường không cần thiết. Tuy nhiên, nên cân nhắc điều chỉnh liều ở những bệnh nhân suy gan nặng và nếu được chỉ định với điều trị dài hạn.

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

Các thuốc được biết có cảm ứng CYP2C19 hoặc CYP3A4 hoặc cả hai (như rifampicin và có St John's) có thể dẫn tới giảm nồng độ omeprazole trong huyết thanh do làm tăng chuyển hóa omeprazole.

*Tương kỵ của thuốc*

Chỉ pha omeprazole trong dịch truyền glucose 5% hoặc natri clorid 0,9%. Không được trộn hoặc pha dung dịch omeprazole để tiêm tĩnh mạch với các dung dịch tiêm truyền tĩnh mạch khác.

**10. Tác dụng không mong muốn của thuốc:**

Các tác dụng phụ thường gặp nhất (1-10% bệnh nhân) là nhức đầu, đau bụng, táo bón, tiêu chảy, đầy hơi và buồn nôn/nôn.

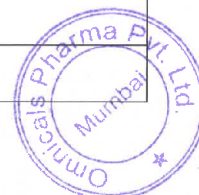
Các phản ứng có hại dưới đây được xác định hoặc nghi ngờ trong các chương trình thử nghiệm lâm sàng của omeprazole và sau khi đưa ra thị trường. Không có tác dụng nào liên quan đến liều. Các tác dụng không mong muốn liệt kê dưới đây được phân loại theo tần suất và hệ cơ quan (SOC-System Organ Class). Các tần suất được định nghĩa như sau: Rất thường gặp (>1/10), thường gặp ( $\geq 1/100$  đến < 1/10), ít gặp ( $\geq 1/1000$  đến < 1/100), hiếm gặp ( $\geq 1/10000$  đến < 1/1000), rất hiếm gặp (< 1/10000), chưa biết (không thể dự đoán được từ dữ liệu hiện có).

<b>Hệ cơ quan/Tần suất</b>	<b>Phản ứng không mong muốn</b>
<i>Rối loạn máu và hệ bạch huyết</i>	
Hiếm gặp:	Giảm bạch cầu, giảm tiểu cầu
Rất hiếm gặp:	Mất bạch cầu hạt, giảm toàn thể huyết cầu
<i>Rối loạn hệ miễn dịch</i>	
Hiếm gặp:	Phản ứng quá mẫn như là sốt, phù mạch, phản ứng phản vệ/sốc phản vệ
<i>Rối loạn chuyển hóa và dinh dưỡng</i>	
Hiếm gặp:	Giảm natri máu
Chưa biết:	Hạ magnesi huyết
<i>Rối loạn tâm thần</i>	
Ít gặp:	Mất ngủ
Hiếm gặp:	Kích động, lú lẫn, trầm cảm
Rất hiếm:	Nóng nảy, ảo giác
<i>Rối loạn hệ thần kinh</i>	



Thường gặp:	Nhức đầu
Ít gặp:	Choáng váng, dị cảm, ngủ gà
Hiếm gặp:	Rối loạn vị giác
<i>Rối loạn mắt</i>	
Hiếm gặp:	Nhìn mờ
<i>Rối loạn tai và mê đạo</i>	
Ít gặp:	Chóng mặt
<i>Rối loạn hô hấp, ngực và trung thất</i>	
Hiếm gặp:	Co thắt phế quản
<i>Rối loạn tiêu hóa</i>	
Thường gặp:	Đau bụng, táo bón, tiêu chảy, đầy bụng, buồn nôn/nôn, polyp tuyến đáy vị (lành tính)
Hiếm gặp:	Khô miệng, viêm miệng, nhiễm candida đường tiêu hóa, viêm đại tràng vi thể
<i>Rối loạn gan mật</i>	
Ít gặp:	Tăng enzym gan
Hiếm gặp:	Viêm gan có hoặc không vàng da
Rất hiếm:	Suy gan, bệnh não ở bệnh nhân đã có bệnh gan
<i>Rối loạn da và mô dưới da</i>	
Ít gặp:	Viêm da, ngứa, nổi mẩn, mề đay
Hiếm gặp:	Hội chứng ánh sáng, nhạy cảm với ánh sáng
Rất hiếm:	Hồng ban đa dạng, hội chứng Stevens-Johnson, hoại tử biểu bì gây độc (TEN)
Chưa biết:	Lupus ban đỏ bán cấp ở da
<i>Rối loạn cơ xương và mô liên kết</i>	
Ít gặp:	Gãy xương hông, xương cổ tay hoặc cột sống
Hiếm gặp:	Đau khớp, đau cơ
Rất hiếm:	Yếu cơ
<i>Rối loạn thận và tiết niệu</i>	
Hiếm gặp:	Viêm thận kẽ
<i>Rối loạn hệ sinh sản và tuyến vú</i>	
Rất hiếm:	Nữ hóa tuyến vú
<i>Các rối loạn tổng quát và tại chỗ</i>	
Ít gặp:	Khó ở, phù ngoại biên
Hiếm gặp:	Tăng tiết mồ hôi

**Thông báo cho bác sĩ những tác dụng không mong muốn gặp phải khi dùng thuốc**



### 11. Quá liều và cách xử trí:

Có rất ít thông tin về ảnh hưởng của quá liều omeprazole ở người. Trong y văn, liều lên tới 560 mg đã được mô tả và đôi khi có báo cáo khi liều đơn uống đạt tới 2400 mg omeprazole (gấp 120 lần liều khuyến cáo thông thường trên lâm sàng). Buồn nôn, nôn, chóng mặt, đau bụng, tiêu chảy và nhức đầu đã được báo cáo. Sự thờ ơ, trầm cảm và lú lẫn cũng được mô tả trong một số trường hợp.

Các triệu chứng được mô tả là thoáng qua và không có hậu quả nghiêm trọng nào được báo cáo. Tốc độ thải trừ không thay đổi (động học bậc một) khi tăng liều. Điều trị, nếu cần thiết, là điều trị triệu chứng.

Liều tiêm tĩnh mạch lên đến 270 mg trong 1 ngày và lên đến 650 mg trong 3 ngày đã được nghiên cứu trong các thử nghiệm lâm sàng mà không có bất cứ phản ứng ngoại ý liên quan đến liều nào.

### 12. Đặc tính dược lực học:

**Nhóm dược lý:** *Ức chế bơm proton*

**Mã ATC:** *A02BC01*

**Cơ chế tác dụng:**

Omeprazole, một hỗn hợp racemic của hai đồng phân làm giảm sự tiết acid dịch vị thông qua cơ chế tác dụng tại đích. Thuốc ức chế đặc hiệu bơm axít trên tế bào thành. Thuốc khởi phát tác dụng nhanh và kiểm soát tác động thông qua việc ức chế thuận nghịch sự tiết axít dịch vị với liều dùng hàng ngày.

Omeprazole là một base yếu, được tập trung và biến đổi thành dạng có hoạt tính trong môi trường axít cao của tế bào thành, tại đây thuốc ức chế bơm H<sup>+</sup>K<sup>+</sup>ATPase. Thuốc tác động vào giai đoạn cuối của quá trình sản xuất axít dịch vị, tác dụng này phụ thuộc vào liều và ức chế có hiệu quả cả sự tiết axít cơ bản lẫn sự tiết axít do kích thích, bất kể tác nhân kích thích gây tiết acid.

**Tác dụng dược lực học**

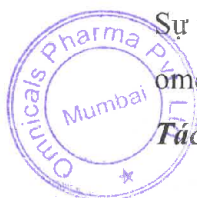
Tất cả các tác dụng dược lực học quan sát được có thể được giải thích bằng tác dụng của omeprazole lên sự tiết acid.

**Tác dụng lên sự tiết acid**

Omeprazole đường tĩnh mạch tạo ra sự ức chế tiết acid dạ dày phụ thuộc vào liều ở người. Để ngay lập tức đạt được mức giảm độ acid trong dạ dày tương tự như sau khi dùng liều lặp lại với liều 20 mg đường uống, nên dùng liều đầu tiên 40 mg đường tĩnh mạch. Điều này dẫn đến giảm nồng độ acid trong dạ dày ngay lập tức và sau 24 giờ nồng độ acid dạ dày giảm khoảng 90% đối với cả tiêm tĩnh mạch và truyền tĩnh mạch.

Sự ức chế tiết acid dạ dày phụ thuộc diện tích dưới đường cong (AUC) không phụ thuộc nồng độ omeprazole tại một thời điểm.

**Tác dụng lên *H. pylori***



*H. pylori* có liên quan đến bệnh loét dạ dày tá tràng, bao gồm cả bệnh loét tá tràng và dạ dày. *H. pylori* là yếu tố chính trong sự phát triển của viêm dạ dày. *H. pylori* cùng với acid dạ dày là những yếu tố chính gây ra bệnh loét dạ dày tá tràng. *H. pylori* là yếu tố chính trong sự phát triển của viêm teo dạ dày, có liên quan đến việc tăng nguy cơ phát triển ung thư dạ dày.

Việc loại trừ *H.pylori* bằng omeprazole và thuốc kháng sinh có liên quan đến tỷ lệ chữa lành cao và thuyên giảm lâu dài các vết loét dạ dày tá tràng.

### ***Các tác dụng khác liên quan đến ức chế acid***

Trong thời gian điều trị lâu dài, u nang tuyến dạ dày đã được báo cáo với tần suất tăng lên đôi chút. Những thay đổi này là hậu quả sinh lý của sự ức chế tiết acid rõ rệt, lành tính và dường như có thể hồi phục được.

Giảm độ acid dạ dày do bất kỳ phương tiện nào, kể cả thuốc ức chế bơm proton, làm tăng số lượng vi khuẩn dạ dày thường có trong đường tiêu hóa. Điều trị bằng các thuốc giảm acid có thể làm tăng nhẹ nguy cơ nhiễm khuẩn đường tiêu hóa như *Salmonella* và *Campylobacter*.

Trong quá trình điều trị bằng các thuốc kháng tiết, gastrin huyết thanh tăng lên để đáp ứng với việc giảm tiết acid. CgA cũng tăng do độ acid dạ dày giảm. Mức CgA tăng lên có thể cản trở việc điều tra các khối u thần kinh nội tiết. Bằng chứng được công bố hiện có cho thấy nên ngừng sử dụng thuốc ức chế bơm proton từ 5 ngày đến 2 tuần trước khi đo CgA. Điều này cho phép mức CgA có thể tăng cao một cách giả tạo sau khi điều trị bằng PPI trở về mức tham chiếu.

### **13. Đặc tính dược động học:**

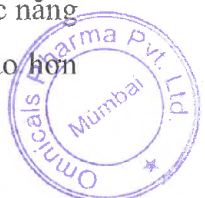
#### ***Phân bố***

Thể tích phân bố biểu kiến ở đối tượng khỏe mạnh là khoảng 0.3 l/kg trọng lượng cơ thể. 97% thuốc gắn với protein huyết tương.

#### ***Chuyển hóa***

Omeprazole chuyển hóa hoàn toàn bởi hệ thống cytochrom P450 (CYP). Phần lớn quá trình chuyển hóa phụ thuộc vào enzym đa hình CYP2C19, chịu trách nhiệm chuyển hóa omeprazol thành hydroxyomeprazol, chất chuyển hóa chính trong huyết tương. Phần còn lại phụ thuộc vào đồng phân khác là CYP3A4, chịu trách nhiệm tạo thành omeprazole sulphone. Do omeprazole có ái lực cao với CYP2C19 nên tiềm tàng sự ức chế cạnh tranh và tương tác chuyển hóa thuốc thuốc với các cơ chất khác của CYP2C19. Tuy nhiên, do ái lực thấp với CYP3A4 omeprazole không có khả năng ức chế sự chuyển hóa các cơ chất khác của CYP3A4. Thêm vào đó omeprazole không có tác động ức chế lên các enzym CYP chính.

Khoảng 3% dân số da trắng và 15-20% dân số Châu Á không có enzym chức năng CYP2C19 và được gọi là những người chuyển hóa kém. Ở những người này, sự chuyển hóa omeprazole có thể được xúc tác chủ yếu bởi enzym CYP3A4. Sau liều lặp lại omeprazole 20mg/1 lần/ ngày, AUC trung bình ở người chuyển hóa kém cao hơn từ 5 đến 10 lần ở các đối tượng có enzym chức năng CYP2C19 (người chuyển hóa mạnh). Nồng độ đỉnh trung bình trong huyết tương cũng cao hơn từ 3 đến 5 lần. Các phát hiện này không ảnh hưởng tới liều dùng của omeprazole.



### *Thải trừ*

Độ thanh thải huyết tương tổng cộng khoảng 30-40 l/giờ sau một liều duy nhất. Thời gian bán thải của omeprazole trong huyết tương thường ngắn hơn một giờ sau khi dùng liều duy nhất và liều lặp lại mỗi ngày một lần. Omeprazole được thải trừ hoàn toàn khỏi huyết tương giữa các liều mà không có khuynh hướng tích lũy khi sử dụng một lần mỗi ngày. Gần 80% liều omeprazole được bài tiết dưới dạng chất chuyển hóa trong nước tiểu, phần còn lại qua phân, chủ yếu xuất phát từ tiết mật.

### *Tuyến tính/phi tuyến tính*

AUC của omeprazole tăng khi dùng lặp lại. Sự gia tăng này phụ thuộc vào liều và dẫn đến mối quan hệ phi tuyến tính giữa liều lượng và AUC sau khi dùng liều lặp lại. Sự phụ thuộc vào thời gian và liều lượng này là do sự giảm chuyển hóa bước đầu và độ thanh thải toàn thân có thể do omeprazole và/hoặc các chất chuyển hóa của nó (ví dụ sulphone) ức chế enzyme CYP2C19.

Không có chất chuyển hóa nào được tìm thấy có tác dụng lên sự tiết acid dạ dày.

### *Các nhóm bệnh nhân đặc biệt:*

#### *Suy gan*

Sự chuyển hóa của omeprazole ở bệnh nhân suy gan giảm đi, dẫn đến tăng AUC. Omeprazol không có xu hướng chùng liều khi sử dụng ngày 1 lần.

#### *Suy thận*

Dược động học của omeprazole, bao gồm cả sinh khả dụng toàn thân và tốc độ thải trừ không thay đổi ở bệnh nhân suy thận.

#### *Người cao tuổi*

Tốc độ chuyển hóa của omeprazole hơi giảm ở đối tượng người cao tuổi (75 -79 tuổi).

**14. Quy cách đóng gói:** Hộp 1 lọ + 1 ống dung môi Nước vô khuẩn pha tiêm 10 ml

### **15. Điều kiện bảo quản, hạn dùng, tiêu chuẩn chất lượng của thuốc:**

Bảo quản: ở nhiệt độ không quá 30°C. Tránh ánh sáng. Sau khi hoàn nguyên, bảo quản ở nhiệt độ không quá 30°C.

Hạn dùng: 24 tháng kể từ ngày sản xuất. Sau khi hoàn nguyên, sử dụng trong vòng 12 giờ ở nhiệt độ không quá 30°C.

Tiêu chuẩn chất lượng: TCCS

### **16. Tên, địa chỉ cơ sở sản xuất thuốc:**

**KAMLA LIFESCIENCES LTD**

Địa chỉ: Plot No G-84/1 Tarapur MIDC Boisar Palghar 401506 Maharashtra State, Ấn Độ

### **17. Tên, địa chỉ cơ sở đăng ký thuốc:**

**OMNICALS PHARMA PRIVATE LIMITED**

Địa chỉ: Navi Mumbai, Ấn Độ

