

Rx - Thuốc này chỉ dùng theo đơn thuốc
KAGASDINE
ĐỂ THUỐC XA TẮM TAY TRẺ EM.
ĐỌC KỸ HƯỚNG DẪN SỬ DỤNG TRƯỚC KHI DÙNG.
THÔNG BÁO NGAY CHO BÁC SỸ HUNG ĐƯỢC SỰ NHƯNG TÁC DỤNG
KHÔNG MONG MUỐN GẶP PHẢI KHI SỬ DỤNG THUỐC.
THUỐC NÀY CHỈ DÙNG THEO ĐƠN CỦA BÁC SỸ.
NẾU CẦN THÊM THÔNG TIN XIN HỎI Ý KIẾN BÁC SỸ

Viên nang cứng

THÀNH PHẦN CÔNG THỨC THUỐC **1 viên nang cứng**
Thành phần được chất: Omeprazol (dưới dạng Omeprazol pellet 8,5%)...20 mg
Thành phần tá dược gồm: (Mannitol, disodium hydrogen ortho phosphate, sodium lauryl sulphate, calcium carbonate, pharma grade sugar, starch, hydroxy propyl methyl cellulose-E5, methacrylic acid copolymer-L30 D, diethyl phthalate, talc, titanium dioxide, sodium hydroxide, polyorbate 80, methyl paraben sodium, propyl paraben sodium) tá dược có trong thành phần omeprazol pellets 8,5%, talc và đủ 1 viên nang cứng

DANG BẢO CHẾ: viên nang cứng
MÔ TẢ SẢN PHẨM: viên nang cứng nang số 1, màu nâu – hồng, bên trong có dạng hạt nhỏ màu trắng ngà.

CHỈ ĐỊNH:
Người lớn:
Điều trị loét dạ dày
Dự phòng loét dạ dày tái phát
Điều trị loét tá tràng
Dự phòng tá tràng tái phát.
Phối hợp với kháng sinh thích hợp trong phác đồ diệt trừ *H.pylori* ở bệnh nhân loét dạ dày-tá tràng.
Điều trị loét dạ dày và tá tràng do NSAIDs
Phòng ngừa nguy cơ loét dạ dày và tá tràng do NSAIDs
Điều trị trào ngược dạ dày thực quản.
Điều trị kéo dài cho bệnh nhân đã chữa khỏi trào ngược thực quản
Điều trị triệu chứng bệnh trào ngược dạ dày- thực quản.
Điều trị hội chứng Zollinger-Ellison.

Trẻ em:
- Trẻ từ 1 tuổi trở lên và ≥ 10 kg:
Điều trị trào ngược thực quản
Điều trị triệu chứng ợ nóng và trào ngược acid ở bệnh nhân bị trào ngược dạ dày- thực quản.
- Trẻ em và thanh thiếu niên trên 4 tuổi; Phối hợp với kháng sinh thích hợp trong phác đồ diệt trừ *H.pylori* trong bệnh loét dạ dày-tá tràng.

LIỀU DÙNG, CÁCH DÙNG:
- Liều dùng:
*Người lớn:
Điều trị loét tá tràng: Liều khuyến cáo cho bệnh nhân loét tá tràng thể hoạt động là 20mg/ngày. Hầu hết bệnh nhân khỏi bệnh trong vòng 2 tuần. Nếu vẫn còn triệu chứng hoặc biểu hiện tổn thương chưa liền, có thể điều trị thêm 2 tuần nữa. Ở bệnh nhân đáp ứng kém với thuốc có thể dùng liều 40mg/ngày và thường được chữa khỏi trong 4 tuần.
Dự phòng tái phát loét tá tràng: Để dự phòng tái phát loét tá tràng ở bệnh nhân có *H.pylori* âm tính hoặc việc loại trừ *H.pylori* không thể thực hiện, liều khuyến cáo 20mg/ngày. Một vài bệnh nhân có thể đáp ứng đầy đủ với liều 10mg/ngày. Trong trường hợp điều trị thất bại có thể tăng lên liều 40 mg/ngày.
Điều trị loét dạ dày: Liều khuyến cáo 20mg/ngày. Hầu hết bệnh nhân chữa khỏi trong vòng 4 tuần. Nếu bệnh nhân chưa được chữa khỏi hoàn toàn, có thể điều trị thêm 4 tuần nữa. Những bệnh nhân đáp ứng kém với liều điều trị, có thể dùng liều 40mg/ngày và bệnh thường khỏi trong vòng 8 tuần điều trị.
Dự phòng tái phát loét dạ dày: Liều dự phòng cho loét dạ dày tái phát ở bệnh nhân loét dạ dày đáp ứng điều trị kém là 20 mg/ngày. Có thể tăng lên liều 40mg/ngày nếu cần.
Diệt *H.pylori* trong bệnh loét dạ dày-tá tràng: để diệt *H.pylori*, việc lựa chọn kháng sinh nên cân nhắc đến khả năng dung nạp thuốc của từng bệnh nhân và được thực hiện theo các hướng dẫn điều trị và dạng kháng thuốc ở quốc gia, khu vực hoặc địa phương:
Omeprazol 20mg + clarithromycin 500mg + amoxicillin 1g, ngày 2 lần uống trong 1 tuần hoặc
Omeprazol 20mg + clarithromycin 250mg + metronidazol 400mg (hoặc 500mg hoặc tinidazol 500mg) x 2 lần/ngày trong 1 tuần hoặc
Omeprazol 40mg/ngày + amoxicillin 500mg + metronidazol 400mg (hoặc 500mg hoặc tinidazol 500mg) x 3 lần/ngày uống trong 1 tuần
Trong mỗi phác đồ điều trị, có thể cho bệnh nhân điều trị lặp lại nếu vẫn còn dương tính với *H.pylori*.
Điều trị loét dạ dày và tá tràng do NSAIDs: liều khuyến cáo 20mg/ngày. Hầu hết bệnh nhân khỏi trong vòng 4 tuần điều trị. Những bệnh nhân chưa khỏi hoàn toàn, có thể điều trị thêm 4 tuần nữa.
Dự phòng loét dạ dày và tá tràng do NSAIDs ở những bệnh nhân có nguy cơ (tuổi >60, tiền sử loét dạ dày-tá tràng, có tiền sử chảy máu đường tiêu hóa trên): liều khuyến cáo 20mg/ngày.
Điều trị trào ngược thực quản: liều khuyến cáo 20mg/ngày, uống trong 4 tuần, có thể uống thêm 4 tuần nữa nếu chưa khỏi hoàn toàn. Ở bệnh nhân nặng, liều khuyến cáo 40mg/ngày uống trong 8 tuần.
Điều trị kéo dài cho bệnh nhân đã chữa khỏi trào ngược thực quản: liều khuyến cáo 10mg/ngày, có thể tăng lên 20-40mg/ngày nếu cần.
Điều trị triệu chứng bệnh trào ngược dạ dày- thực quản: liều khuyến cáo 20mg/ngày. Cần nhắc điều chỉnh liều cho từng bệnh nhân. Nếu không thể kiểm soát được các triệu chứng trong vòng 4 tuần, nên cân nhắc việc ra soát thêm cho bệnh nhân.
Điều trị hội chứng Zollinger-Ellison: nên điều chỉnh liều theo từng bệnh nhân và tiếp tục điều trị khi còn chỉ định trên lâm sàng. Liều khuyến cáo 60mg/ngày. Những bệnh nhân bệnh nặng và không đáp ứng đầy đủ với các liệu pháp khác được kiểm soát hiệu quả và trên 90% bệnh nhân được duy trì ở liều 20-120mg/ngày. Nên chia uống ngày 2 lần khi liều dùng vượt quá 80mg/ngày.

Các đối tượng đặc biệt:
Trẻ em trên 1 tuổi và ≥ 10 kg:
Điều trị trào ngược thực quản, điều trị triệu chứng ợ nóng và trào ngược acid ở bệnh nhân bị trào ngược dạ dày- thực quản
Liều khuyến cáo như sau:
 ≥ 1 tuổi: 10-20 kg: 10 mg/ngày, có thể tăng lên liều 20mg/ngày nếu cần
 ≥ 2 tuổi: > 20 kg: 20 mg/ngày, có thể tăng lên liều 40mg/ngày nếu cần
Điều trị trào ngược thực quản: 4 - 8 tuần
Điều trị triệu chứng ợ nóng và trào ngược acid ở bệnh nhân bị trào ngược dạ dày- thực quản: 2 - 4 tuần. Nên tiến hành ra soát thêm nếu không thể cải thiện triệu chứng sau 2 - 4 tuần.
Trẻ em và thanh thiếu niên trên 4 tuổi:
Điều trị loét tá tràng do nhiễm *H.pylori*: khi lựa chọn liệu pháp phối hợp phù hợp cho bệnh nhân nên xem xét các hướng dẫn chính thức tại các quốc gia, khu vực và địa phương về đề kháng vi khuẩn, thời gian điều trị (thường là 7 ngày nhưng có khi lên đến 14 ngày) và sử dụng kháng sinh hợp lý. Nên tiến hành điều trị dưới sự giám sát của bác sĩ. Liều khuyến cáo như sau:
31- 40kg: omeprazol 20mg + amoxicillin 750mg + clarithromycin 7,5mg/kg cân nặng, uống 2 lần/ngày trong 1 tuần
> 40kg: omeprazol 20mg + amoxicillin 1g + clarithromycin 500mg, uống 2 lần/ngày trong 1 tuần
Suy gan: liều khuyến cáo 10-20 mg/ngày
Suy thận, người cao tuổi (≥ 65 tuổi): không cần chỉnh liều
- Cách dùng: Khuyến cáo dùng thuốc vào buổi sáng, nuốt nguyên viên thuốc với nửa cốc nước, không nhai hay nghiền viên thuốc.

CHỐNG CHỈ ĐỊNH:
Quá mẫn với omeprazole, các dẫn chất nhóm benzimidazol hoặc quá mẫn với bất kỳ thành phần nào của thuốc
Không nên sử dụng đồng thời với nelfinavir.

CẢNH BÁO VÀ THẬN TRỌNG KHI DÙNG THUỐC:
Khi có các triệu chứng cảnh báo (như giảm cân không chủ ý, nôn tái diễn định kỳ, khó nuốt, nôn ra máu, thiếu máu hoặc đại tiện phân đen) và khi nghi ngờ hoặc bị loét dạ dày, phải loại trừ khả năng xuất hiện các bệnh lý ác tính (như ung thư) vì thuốc có thể che lấp triệu chứng và làm chậm chẩn đoán.
Không khuyến cáo sử dụng kèm atazanavir với các thuốc ức chế bơm proton. Trong trường hợp việc phối hợp 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 omeprazol. Omeprazol, cũng như các thuốc ức chế tiết axit khác, có thể giảm hấp thu vitamin B12 (cyanocobalamin) do giảm hoặc thiếu axit 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.
Omeprazol là một chất ức chế CYP2C19. Khi bắt đầu hoặc kết thúc điều trị với omeprazol nên cân nhắc đến các tương tác tiềm tàng với các thuốc chuyển hóa qua CYP2C19. Để có ghi nhận tương tác giữa clopidogrel và omeprazol, Chưa rõ mối tương quan lâm sàng của tương tác này. Nhằm mục đích thận trọng, không nên dùng đồng thời omeprazol và clopidogrel.
Giảm magnes huyết nghiêm trọng đã được báo cáo ở những bệnh nhân điều trị bằng các thuốc ức chế bơm proton như omeprazol trong ít nhất ba tháng, và trong đa số các trường hợp là 1 năm. Các triệu chứng nghiêm trọng của hạ magnes huyết như là mệt mỏi, cơ cứng cơ, mê sảng, cơ giật, co giật, chuột rút, và loạn nhịp thất có thể xảy ra, nhưng các biểu hiện này có thể khó phát âm trầm và không được lưu tâm. Trong đa số các trường hợp, tình trạng hạ magnes huyết có thể được cải thiện khi được bổ sung magnes 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 magnes huyết (như thuốc lợi tiểu), các chuyên viên y tế nên xem xét đo nồng độ magnes 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 gây 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 gây 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.
Lupus ban đỏ bản cấp ở da (SCLE): đã có báo cáo SCLE ở bệnh nhân đang dùng các thuốc ức chế bơm proton. Nếu có tổn thương xảy ra đặc biệt là vùng da tiếp xúc trực tiếp với ánh nắng mặt trời, có dị cảm đau khớp, khuyến cáo bệnh nhân đến gặp bác sĩ và cân nhắc ngưng thuốc.
Bệnh nhân đã có tiền sử bị SCLE sau khi dùng một thuốc ức chế bơm proton có thể tăng nguy cơ bị SCLE với các thuốc ức chế bơm proton khác.
Ảnh hưởng đến các xét nghiệm: nồng độ chromogranin (CgA) tăng lên có thể ảnh hưởng đến việc dò tìm các khối u thần kinh nội tiết. Nhằm tránh sự can thiệp này, nên ngưng điều trị bằng omeprazol ít nhất 5 ngày trước khi tiến hành đo CgA.
Một số trẻ em mắc bệnh mãn tính có thể cần phải điều trị kéo dài mặc dù không được khuyến cáo.
Điều trị với các thuốc ức chế bơm proton có thể làm tăng nhẹ nguy cơ nhiễm trùng đường tiêu hóa như *Salmonella* và *Campylobacter*, ở bệnh nhân nội trú có thể có nguy cơ nhiễm *Clostridium difficile*.
Khi điều trị dài hạn, đặc biệt khi kéo dài trên 1 năm, bệnh nhân nên được giám sát thường xuyên.

SỬ DỤNG THUỐC CHO PHỤ NỮ CÓ THAI VÀ CHO CON BÚ:
Phụ nữ có thai: kết quả từ một số nghiên cứu dịch tễ học cho thấy không có tác dụng không mong muốn của omeprazol trên phụ nữ có thai hoặc sức khỏe của thai nhi trẻ sơ sinh. Có thể dùng omeprazol trong thời kỳ mang thai.
Phụ nữ cho con bú: omeprazol được tiết vào sữa mẹ nhưng hầu như không ảnh hưởng đến trẻ bú mẹ khi đang dùng thuốc ở liều điều trị
Khả năng sinh sản: nghiên cứu trên động vật với đồng phân racemic của omeprazol dùng đường uống không thấy có ảnh hưởng lên khả năng sinh sản.

ẢNH HƯỞNG CỦA THUỐC LÊN KHẢ NĂNG LÃI XE VÀ VẬN HÀNH MÁY MÓC:

Omeprazol hầu như không ảnh hưởng đến khả năng lái xe và vận hành máy móc. Tuy nhiên, các tác dụng không mong muốn như chóng mặt, rối loạn thị giác có thể xảy ra. Do vậy, nếu xảy ra các phản ứng này, bệnh nhân không nên lái xe hay điều khiển máy móc.

TƯƠNG TÁC, TƯƠNG KỶ CỦA THUỐC:

Ảnh hưởng của omeprazol trên được động học của các thuốc khác:

*** Các thuốc hấp thu phụ thuộc pH:**

Việc giảm độ acid dạ dày khi điều trị bằng omeprazol và các PPI khác có thể làm giảm hay tăng sự hấp thu của các thuốc khác có cơ chế hấp thu phụ thuộc pH dạ dày.

Nelfinavir, atazanavir: nồng độ của hai thuốc này có thể giảm khi dùng đồng thời với omeprazol. Chống chỉ định dùng đồng thời omeprazol và nelfinavir, tương tác này có thể liên quan đến ức chế CYP2C19. Không khuyến cáo dùng đồng thời omeprazol và atazanavir.

Digoxin: điều trị đồng thời omeprazol (20mg/ngày) và digoxin có thể làm tăng sinh khả dụng của digoxin lên 10%. Ngộ độc digoxin hiếm gặp đã được báo cáo. Thận trọng khi dùng omeprazol liều cao ở người cao tuổi. Tăng cường theo dõi khi điều trị với digoxin

Clopidogrel: Kết quả từ các nghiên cứu trên đối tượng khỏe mạnh đã chỉ ra tương tác được động/được lực giữa clopidogrel (liều nạp 300mg/ liều duy trì 75mg/ngày) và omeprazol (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%. Dù liệu không nhất quán trong các công bố lâm sàng về tương tác được động/được lực của omeprazol về các biến cố tim mạch chính đã được báo cáo trong 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 của 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 omeprazol.

*** Các thuốc chuyển hóa bởi CYP2C19:**

Omeprazol là một thuốc ức chế trung bình CYP2C19, enzyme chuyển hóa chính của omeprazol. Do đó, sự chuyển hóa của các thuốc phối hợp cũng được chuyển hóa qua CYP2C19 có thể giảm và tăng AUC như R-warfarin và các thuốc kháng vitamin K khác, cilostazol, diazepam và phenytoin.

Cilostazol: dùng đồng thời với omeprazol làm tăng nồng độ cilostazol và chất chuyển hóa có hoạt tính của nó.

Phenytoin: cần theo dõi nồng độ phenytoin huyết tương trong 2 tuần đầu sau khi khởi đầu điều trị với omeprazol và tiến hành theo dõi nếu điều chỉnh liều phenytoin, tiếp tục điều chỉnh lại liều phenytoin khi kết thúc điều trị với omeprazol.

*** Cơ chế chưa rõ:**

Saquinavir: dùng đồng thời omeprazol và saquinavir/ritonavir làm tăng nồng độ saquinavir huyết tương lên 70% liên quan đến khả năng dung nạp tốt ở bệnh nhân HIV.

Tacrolimus: dùng đồng thời với omeprazol làm tăng nồng độ tacrolimus trong huyết thanh. Cần theo dõi chặt chẽ nồng độ tacrolimus cũng như theo dõi chức năng thận của bệnh nhân, điều chỉnh liều tacrolimus nếu cần.

Methotrexat: tăng nồng độ methotrexat ở một vài bệnh nhân khi dùng đồng thời với thuốc ức chế bơm proton. Cần nhắc ngưng tạm thời omeprazol khi cần dùng liều cao methotrexat ở bệnh nhân.

Ảnh hưởng của các thuốc khác trên được động học của omeprazol:

Các thuốc ức chế CYP2C19 và/ hoặc CYP3A4: do omeprazol được chuyển hóa bởi CYP2C19 và CYP3A4 nên khi dùng đồng thời với các thuốc ức chế CYP2C19 hoặc CYP3A4 (như clarithromycin, voriconazol) có thể làm tăng nồng độ omeprazol huyết thanh do giảm chuyển hóa esomeprazol. Điều trị phối hợp với voriconazol có thể làm tăng gấp đôi AUC của omeprazol. Do liều cao omeprazol có khả năng dung nạp tốt, việc điều chỉnh liều là không cần thiết. Tuy nhiên, nên cân nhắc chỉnh liều ở những bệnh nhân suy gan nặng và được chỉ định điều trị trong thời gian kéo dài.

Các thuốc cảm ứng CYP2C19 và/ hoặc CYP3A4: Các thuốc cảm ứng CYP2C19 hoặc CYP3A4 hoặc cả hai (như rifamicin và có St.John (*Hypericum perforatum*)) có thể làm giảm nồng độ omeprazol huyết thanh do làm tăng chuyển hóa omeprazol.

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

TÁC DỤNG KHÔNG MONG MUỐN:

Các tác dụng không mong muốn phổ biến nhất ở bệnh nhân là đau đầu, đau bụng, táo bón, tiêu chảy, đầy hơi và buồn nôn/nôn.

Thường gặp: 1/100 ≤ ADR < 1/10:

Thần kinh: đau đầu. Tiêu hóa: buồn nôn/ nôn, đau bụng, tiêu chảy, táo bón, đầy hơi.

Ít gặp: 1/1000 ≤ ADR < 1/100:

Tâm thần: mất ngủ. Thần kinh: choáng váng, ngủ gà, dị cảm. Da và mô dưới da: viêm da, ngứa, nổi mẩn, mày đay.

Gan: tăng men gan. Cơ xương: gây xương hồng, cổ tay, cột sống. Toàn thân: khó chịu, phù ngoại biên.

Hiếm gặp: 1/1 0000 ≤ ADR < 1/1000:

Máu và hệ bạch huyết: giảm bạch cầu, giảm tiểu cầu. Tâm thần: kích động, lú lẫn, trầm cảm, ảo giác. Chuyển hóa: giảm natri huyết

Miễn dịch: phản ứng quá mẫn như sốt, phù mạch, phản ứng phản vệ/ sốc phản vệ. Tâm thần: kích động, lú lẫn, trầm cảm.

Thần kinh: rối loạn vị giác. Mắt: nhìn mờ. Hô hấp: co thắt phế quản. Tiêu hóa: khô miệng, viêm miệng, nhiễm candida đường tiêu hóa

Gan: viêm gan có hoặc không có vàng da. Da: hội chứng, nhạy cảm với ánh sáng.

Cơ xương: đau cơ, đau khớp. Thận: viêm thận kẽ. Toàn thân: tăng tiết mồ hôi.

Rất hiếm gặp: ADR < 1/10 000:

Máu và hệ bạch huyết: mất bạch cầu hạt, giảm toàn thể huyết cầu. Tâm thần: mộng tưởng, ảo giác.

Gan: suy gan, bệnh não ở những bệnh nhân đã có bệnh gan. Cơ xương: yếu cơ. Sinh sản: nữ hóa tuyến vú

Da và mô dưới da: ban bong nước, hội chứng Stevens-Johnson, hoại tử biểu bì nhiễm độc.

Tần suất chưa rõ:

Chuyển hóa: hạ magnesi huyết, hạ magnesi huyết nghiêm trọng có thể dẫn đến hạ calci huyết hay hạ kali huyết.

Tiêu hóa: viêm đại tràng vi thể.

QUÁ LIỀU VÀ CÁCH XỬ TRÍ:

Triệu chứng: Thông tin về quá liều của omeprazol còn hạn chế. Các triệu chứng quá liều đã được báo cáo: buồn nôn, nôn, chóng mặt, đau bụng, tiêu chảy và nhức đầu. Ngoài ra còn các triệu chứng như lạnh đạm, trầm cảm và lú lẫn cũng đã được mô tả trong một số trường hợp đơn lẻ.

Xử trí: các triệu chứng quá liều của omeprazol được mô tả là thoáng qua và không có dấu hiệu quá nghiêm trọng nào được báo cáo. Tỷ lệ thải trừ thuốc không đổi khi tăng liều. Điều trị triệu chứng nếu cần thiết.

ĐẶC TÍNH ĐƯỢC LỰC HỌC:

Nhóm dược lý: chống loét dạ dày, tá tràng, ức chế bơm proton.

Mã ATC: A02BC01

Cơ chế tác dụng: Omeprazol là 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 acid trên tế bào thành. Thuốc khởi phát tác dụng nhanh và kiểm soát tác động thông qua việc ức chế thuận nghịch sự tiết acid dịch vị với liều dùng hàng ngày. Omeprazol là một base yếu, được tập trung và biến đổi thành dạng có hoạt tính trong môi trường acid cao của tế bào thành, tại đây thuốc ức chế bơm H⁺K⁺ATPase. Thuốc tác động vào giai đoạn cuối của quá trình tiết acid dịch vị, tác dụng này phụ thuộc vào liều và ức chế có hiệu quả cả sự tiết acid cơ bản lẫn sự tiết acid kích thích, bất kể tác nhân kích thích gây tiết acid.

Tác động dược lực học: tất cả các tác động dược lực học quan sát được có thể được giải thích bởi tác động của omeprazol lên sự tiết acid. Uống hàng ngày một liều duy nhất 20mg omeprazol tạo được sự ức chế tiết acid dạ dày mạnh và hiệu quả. Tác dụng tối đa đạt được sau 4 ngày điều trị. Ở bệnh nhân loét tá tràng có thể duy trì việc giảm 80% acid dịch vị trong 24 giờ.

Omeprazol có thể kìm hãm được vi khuẩn *Helicobacter pylori* ở người loét tá tràng và/hoặc trào ngược thực quản bị nhiễm vi khuẩn này. Phối hợp omeprazol với một số kháng sinh (như clarithromycin, amoxicillin) có thể diệt trừ *H.pylori* kèm theo liền ổ loét và thuyên giảm bệnh lâu dài.

ĐẶC TÍNH ĐƯỢC ĐỘNG HỌC:

Hấp thu: omeprazol bị phá hủy trong môi trường acid. Thuốc được bảo chế dưới dạng viên bao tan trong ruột để tránh sự phá hủy ở pH acid của dạ dày. Omeprazol hấp thu nhanh sau khi uống, đạt nồng độ đỉnh sau khoảng 1-2 giờ. Omeprazol thường được hấp thu hoàn toàn ở ruột non sau khi uống từ 3 đến 6 giờ. Dùng đồng thời với thức ăn không ảnh hưởng đến sinh khả dụng của thuốc. Sinh khả dụng của omeprazol sau khi uống liều duy nhất khoảng 40%. Sau khi uống liều lặp lại 1 lần/ngày, sinh khả dụng tăng lên khoảng 60%.

Phân bố: thể tích phân bố của omeprazol ở người khỏe mạnh xấp xỉ 0,3 lít/kg thể trọng. Khoảng 97% omeprazol gắn vào protein huyết tương.

Chuyển hóa: omeprazol được chuyển hóa hầu như hoàn toàn ở gan, chủ yếu nhờ isoenzym CYP2C19 của cytochrom P450 để thành hydroxy omeprazol, và một phần nhỏ được chuyển hóa qua CYP3A4 để thành omeprazolsulfon. Các chất chuyển hóa này không có hoạt tính.

Thải trừ: thời gian bán thải trong huyết tương của omeprazol thường dưới 1 giờ kể cả sau khi uống liều duy nhất và liều lặp lại 1 lần/ ngày. Omeprazol được thải trừ hoàn toàn từ huyết tương giữa các liều, không gây tích lũy khi uống 1 lần/ngày. Khoảng 80% liều uống của omeprazol được thải trừ dưới dạng các chất chuyển hóa qua nước tiểu, phần còn lại được thải trừ qua phân, chủ yếu do sự bài tiết mật.

Sự tuyến tính/không tuyến tính:

AUC của omeprazol tăng khi dùng liều lặp lại. Sự tăng lên này phụ thuộc liều và dẫn đến AUC không tuyến tính với liều sau khi dùng lặp lại. Sự phụ thuộc thời gian và liều này là do giảm chuyển hóa lần đầu qua gan và thanh thải toàn thân, có thể do tác dụng ức chế CYP2C19 của omeprazol và/hoặc chất chuyển hóa của nó (ví dụ như chất chuyển hóa sulfon). Không thấy chất chuyển hóa có tác dụng bất kỳ nào trên sự bài tiết dạ dày.

Được động học trên các đối tượng đặc biệt:

Người chuyển hóa thuốc kém: ở một số người vì thiếu CYP2C19 có hoạt tính do di truyền (15-20% người châu Á), nên làm chậm chuyển hóa omeprazol. Ở những người này, chuyển hóa của omeprazol chủ yếu được xúc tác bởi enzym CYP3A4. Sau khi dùng omeprazol 20mg lặp lại 1 lần/ngày, AUC ở người chuyển hóa thuốc kém tăng khoảng 5 - 10 lần so với người bình thường. Nồng độ đỉnh trong huyết tương cũng cao gấp 3 - 5 lần. Điều này không ảnh hưởng đến liều dùng của omeprazol.

Suy gan: sự chuyển hóa omeprazol ở người bị rối loạn chức năng gan bị suy giảm dẫn đến tăng AUC. Omeprazol không gây tích lũy với liều 1 lần/ ngày.

Suy thận: các thông số dược động của omeprazol bao gồm sinh khả dụng toàn thân và tỷ lệ thải trừ, không thay đổi ở bệnh nhân bị suy giảm chức năng thận.

Người cao tuổi: chuyển hóa omeprazol giảm nhẹ ở người cao tuổi (75-79 tuổi)

Trẻ em: trong quá trình điều trị ở liều khuyến cáo cho trẻ em trên 1 tuổi, nồng độ thuốc trong huyết tương tương tự như ở người lớn. Ở trẻ em dưới 6 tháng tuổi, độ thanh thải omeprazol thấp do khả năng chuyển hóa omeprazol kém.

QUY CÁCH ĐÓNG GÓI: Hộp 2 vỉ x 10 viên nang cứng, hộp 10 vỉ x 10 viên nang cứng, chai 200 viên nang cứng, chai 500 viên nang cứng, chai 1000 viên nang cứng.

BẢO QUẢN - HẠN DÙNG:

Bảo quản: Dưới 30°C, nơi khô ráo, tránh ánh sáng.

Hạn dùng: 36 tháng kể từ ngày sản xuất.

Tiêu chuẩn: ĐVN V