

DƯỢC LÝ HỌC

ĐẶC TÍNH DƯỢC LỰC HỌC

Esomeprazole là dạng đồng phân S- của omeprazole và làm giảm sự bài tiết axit dạ dày bằng một cơ chế tác động chuyên biệt. Thuốc là chất ức chế đặc hiệu bơm axit ở tế bào thành. Cả hai dạng đồng phân R- và S- của omeprazole đều có tác động được lực học tương tự.

Vị trí và cơ chế tác động

Esomeprazole là một base yếu, được tập trung và biến đổi thành dạng có hoạt tính trong môi trường axit cao ở ống tiêu quản chế tiết của tế bào thành, tại đây thuốc ức chế men H⁺-K⁺-ATPase (bơm axit) và ức chế cả sự tiết dịch cơ bản lẫn sự tiết dịch do kích thích.

Tác động lên sự tiết axit dịch vị

Sau khi dùng liều uống esomeprazole 20 mg và 40 mg, thuốc khởi phát tác động trong vòng 1 giờ. Sau khi dùng lặp lại liều esomeprazole 20 mg, 1 lần/ngày trong 5 ngày, sự tiết axit tối đa trung bình sau khi kích thích bằng pentagastrin giảm 90% khi đo ở thời điểm 6-7 giờ sau khi dùng thuốc ở ngày thứ 5.

Sau 5 ngày dùng liều uống esomeprazole 20 mg và 40 mg, độ pH trong dạ dày > 4 đã được duy trì trong thời gian trung bình tương ứng là 13 và 17 giờ trong vòng 24 giờ ở bệnh nhân trào ngược dạ dày thực quản có triệu chứng. Tỷ lệ bệnh nhân duy trì độ pH trong dạ dày > 4 tối thiểu trong 8, 12 và 16 giờ tương ứng là 76%, 54% và 24% đối với esomeprazole 20 mg và 97%, 92% và 56% đối với esomeprazole 40 mg.

Khi dùng AUC như là một tham số đại diện cho nồng độ thuốc trong huyết tương, người ta đã chứng minh được có mối liên hệ giữa sự ức chế tiết axit với nồng độ thuốc và thời gian tiếp xúc.

Tác động trị liệu của sự ức chế axit

Khi dùng esomeprazole 40 mg, khoảng 78% bệnh nhân viêm thực quản do trào ngược được chữa lành sau 4 tuần và khoảng 93% được chữa lành sau 8 tuần.

Điều trị bằng esomeprazole 20 mg, 2 lần/ngày và kháng sinh thích hợp trong 1 tuần đã diệt trừ *Helicobacter pylori* thành công ở khoảng 90% bệnh nhân. Sau khi điều trị diệt trừ trong 1 tuần, không cần dùng thêm thuốc kháng tiết axit để chữa lành loét và giảm triệu chứng ở bệnh nhân loét tá tràng không biến chứng.

Phác đồ điều trị 3 thuốc bao gồm một PPI và 2 kháng sinh nhìn chung được đồng thuận là phác đồ điều trị đầu tay đối với loét tá tràng do *H. pylori* ở trẻ em và người lớn. Dữ liệu về hiệu quả điều trị được ngoại suy từ các nghiên cứu của esomeprazole trên người lớn, cũng như các dữ liệu về sự diệt trừ *H. pylori* được ngoại suy từ các nghiên cứu của omeprazole trên trẻ em cho việc sử dụng esomeprazole trên trẻ em. Một số nghiên cứu lâm sàng được thực hiện riêng biệt cũng đã khẳng định hiệu quả của esomeprazole như là một thành phần trong phác đồ diệt trừ *H. pylori* ở trẻ em.

QUẢ LIỀU

Cho đến nay có rất ít kinh nghiệm về việc dùng quả liều có chủ đích. Các triệu chứng được mô tả có liên quan đến việc dùng liều 280 mg là các triệu chứng trên đường tiêu hóa và tình trạng mệt mỏi. Các liều đơn esomeprazole 80 mg vẫn an toàn khi dùng. Chưa có chất giải độc đặc hiệu. Esomeprazole gắn kết mạnh với protein huyết tương và vì vậy không dễ dàng thẩm phân được. Trong trường hợp quá liều, nên điều trị triệu chứng và sử dụng các biện pháp hỗ trợ tổng quát.