

DƯỢC LÝ HỌC

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

Trẻ em

Trẻ vị thành niên 12-18 tuổi

Sau khi sử dụng liều lặp lại 20 mg và 40 mg esomeprazole, tổng nồng độ và thời gian tiếp xúc (AUC) và thời gian đạt nồng độ tối đa trong huyết tương (t_{max}) ở trẻ 12-18 tuổi tương tự như ở người lớn đối với cả hai liều esomeprazole.

DỮ LIỆU AN TOÀN TIỀN LÂM SÀNG

Các nghiên cứu tiền lâm sàng, dựa trên các nghiên cứu quy ước về độc tính khi dùng liều lặp lại, độc tính trên gen và độc tính trên sự sinh sản cho thấy thuốc không nguy hại cho người. Các nghiên cứu về khả năng gây ung thư trên chuột khi dùng hỗn hợp đồng phân đường uống đã chứng minh có sự tăng sinh tế bào ECL và hạch ung thư. Các tác động này trên dạ dày chuột là kết quả của sự tăng gastrin mẫu thứ phát rõ rệt và kéo dài dễ giảm tiết axit dịch vị và đã được ghi nhận khi cho chuột dùng dài hạn thuốc ức chế tiết axit dịch vị.

TÁ DƯỢC

Glycerol monostearat 40-55, hydroxypropyl cellulose, hypromellose, oxid sắt (viên nén 20 mg và 40 mg: oxid sắt nâu đỏ, viên nén 20 mg: oxid sắt vàng) (E 172), magnesii stearat, methacrylic acid ethyl acrylate copolymer (1:1) dịch phân tán 30%, cellulose vi tinh thể, paraffin tổng hợp, macrogol 6000, polysorbat 80, crospovidon, natri stearyl fumarat, sugar spheres (sucrose và tinh bột ngô), talc, titan dioxide (E 171), triethyl citrat.

TƯƠNG KÝ

Chưa được biết.

HẠN DÙNG

24 tháng kể từ ngày sản xuất.

THẬN TRỌNG ĐẶC BIỆT KHI BẢO QUẢN

Không bảo quản ở nhiệt độ trên 30°C. Giữ thuốc trong bao bì gốc (trong vỉ thuốc) để tránh ẩm.

Tổng độ thanh thải huyết tương khoảng 17 L/giờ sau khi dùng liều đơn và khoảng 9 L/giờ sau khi dùng liều lặp lại. Thời gian bán thải trong huyết tương khoảng 1,3 giờ sau khi dùng liều lặp lại 1 lần/ngày. Được động học của esomeprazole đã được nghiên cứu với liều lên đến 40 mg, 2 lần/ ngày. Diện tích vùng dưới đường cong biểu diễn nồng độ trong huyết tương theo thời gian (AUC) tăng lên sau khi dùng lặp lại esomeprazole. Sự tăng này phụ thuộc theo liều và tỷ lệ gia tăng AUC nhiều hơn tỷ lệ tăng liều sau khi dùng liều lặp lại. Sự phụ thuộc vào thời gian và liều dùng này là do sự giảm chuyển hóa ở giai đoạn đầu qua gan và giảm độ thanh thải toàn thân có lẽ do sự ức chế men CYP2C19 của esomeprazole và/hoặc chất chuyển hóa suiphone. Esomeprazole thải trừ hoàn toàn khỏi huyết tương giữa các liều dùng mà không có khuynh hướng tích lũy khi dùng 1 lần/ngày.

Các chất chuyển hóa chính của esomeprazole không ảnh hưởng đến sự tiết axit dạ dày. Khoảng 80% esomeprazole liều uống được bài tiết qua nước tiểu dưới dạng các chất chuyển hóa, phần còn lại qua phân. Ít hơn 1% thuốc dạng không đổi được tìm thấy trong nước tiểu.

Các nhóm bệnh nhân đặc biệt

Khoảng $2,9 \pm 1,5\%$ 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 của esomeprazole được xúc tác chủ yếu bởi CYP3A4. Sau khi dùng liều lặp lại esomeprazole 40 mg, 1 lần/ngày, AUC trung bình ở người chuyển hóa kém cao hơn khoảng 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 esomeprazole. Sự chuyển hóa của esomeprazole không thay đổi đáng kể ở bệnh nhân cao tuổi (71-80 tuổi).

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

Bệnh nhân suy giảm chức năng các cơ quan

Sự chuyển hóa của esomeprazole 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 esomeprazole. Vì vậy, không dùng quá liều tối đa 20 mg ở bệnh nhân rối loạn chức năng gan nặng. Esomeprazole hoặc các chất chuyển hóa chính không có khuynh hướng tích lũy khi dùng 1 lần/ngày.

Handwritten signature and date:
12/3/14

