

Các thuốc khác: Omeprazol làm giảm đáng kể hấp thu posaconazol, erlotinib, ketoconazol và itraconazol; do đó nên tránh dùng đồng thời omeprazol với các thuốc này.

Thuốc bị chuyển hóa bởi cytochrom CYP2C19
Omeprazol làm giảm chuyển hóa các thuốc khi dùng đồng thời các thuốc bị chuyển hóa bởi cytochrom CYP2C19 như warfarin và các thuốc kháng vitamin K.

khác, citalopram, diazepam và phenytoin, do đó nên thận trọng khi dùng đồng thời omeprazol với các thuốc này.

Tác dụng của các thuốc khác lên được động học của omeprazol

Thuốc ức chế cytochrom CYP2C19 và/hoặc CYP3A4: Vì omeprazol bị chuyển hóa bởi cytochrom CYP2C19 và CYP3A4, các thuốc được biết là ức chế CYP2C19 hoặc CYP3A4 (như clarithromycin và voriconazole) có thể làm tăng nồng độ omeprazol trong huyết thanh do làm giảm tốc độ chuyển hóa omeprazol.

Thuốc gây cảm ứng cytochrom CYP2C19 và/hoặc CYP3A4: Thuốc gây cảm ứng cytochrom CYP2C19 và/hoặc CYP3A4 như rifampicin có thể làm giảm nồng độ omeprazol trong huyết thanh do làm tăng tốc độ chuyển hóa omeprazol.

TÁC DỤNG KHÔNG MONG MUỐN

Omeprazol dung nạp tốt và các tác dụng không mong muốn tương đối ít gặp, thường lành tính và có hồi phục, thường gặp nhất là nhức đầu, đau bụng, táo bón, tiêu chảy, đầy hơi, buồn nôn, nôn ói.

Tần suất xảy ra tác dụng không mong muốn (ADR) được phân loại theo quy ước sau: Rất thường gặp (ADR > 1/10), thường gặp (1/100 < ADR < 1/10), ít gặp (1/1.000 < ADR < 1/100), hiếm gặp (1/10.000 < ADR < 1/1.000), rất hiếm gặp (ADR < 1/10.000), chưa biết (không thể ước lượng được dựa vào dữ liệu sẵn có).

Rối loạn máu và hệ bạch huyết

Hiếm gặp: Giảm bạch cầu, giảm tiểu cầu

Rất hiếm gặp: Mất bạch cầu hạt, giảm toàn thể huyết cầu

Rối loạn hệ miễn dịch

Hiếm gặp: Phản ứng quá mẫn như sốt, phù mạch, phản ứng phản vệ hoặc sốc phản vệ

Rối loạn chuyển hóa và dinh dưỡng

Hiếm gặp: Hạ natri huyết

Chưa biết: Hạ magesi huyết

Rối loạn tâm thần

Ít gặp: Mất ngủ

Hiếm gặp: Kích động, lú lẫn, trầm cảm

Rất hiếm gặp: Ảo giác

Rối loạn hệ thần kinh

Thường gặp: Nhức đầu

Ít gặp: Chóng mặt, dị cảm, ngủ gà

Hiếm gặp: Rối loạn vị giác

Rối loạn mắt

Hiếm gặp: Nhìn mờ

Rối loạn thính giác

Ít gặp: Hoa mắt

Rối loạn hô hấp, ngực và trung thất

Hiếm gặp: Có thể phù quản

Rối loạn tiêu hóa

Thường gặp: Đau bụng, táo bón, tiêu chảy, đầy hơi, buồn nôn/nôn ói

Hiếm gặp: Khô miệng, viêm miệng, nhiễm nấm *Candida* tiêu hóa

Rối loạn gan-mật

Ít gặp: Tăng enzym gan

Hiếm gặp: Viêm gan có kèm vàng da hoặc không vàng da

Rất hiếm gặp: Suy gan, bệnh não ở bệnh nhân trước đó bị bệnh gan

Rối loạn da và mô dưới da

Ít gặp: Viêm da, ngứa, ngoại ban, mày đay

Hiếm gặp: Rụng tóc, nhạy cảm với ánh sáng

Rất hiếm gặp: Hồng ban da dạng, hội chứng Stevens-Johnson, hoại tử biểu bì nhiễm độc

Rối loạn cơ-xương và mô liên kết

Ít gặp: Gãy xương cổ tay, khớp háng hoặc xương sống

Hiếm gặp: Đau khớp, đau cơ

Rất hiếm gặp: Như cơ

Rối loạn thận và tiết niệu

Hiếm gặp: Viêm thận kẽ

Rối loạn vú và hệ sinh sản

Rất hiếm gặp: Chậm vú và to ở đàn ông

Các rối loạn khác

Ít gặp: Khó chịu, phù ngoại biên

Hiếm gặp: Tăng tiết mồ hôi

Ngưng sử dụng và báo ngay với bác sĩ nếu xảy ra các triệu chứng sau: Thở khó khẽ, phù môi/lưỡi/họng/toàn thân, nổi mẩn, nổi hạch, da đỏ kèm theo bong rộp, vàng da, nước tiểu sẫm màu và một mồi.

Thông báo ngay cho bác sĩ hoặc dược sĩ những phản ứng có hại gặp phải khi sử dụng thuốc

QUÁ LIỀU VÀ XỬ TRÍ

Triệu chứng

Có rất ít thông tin về quá liều omeprazol ở người. Các triệu chứng như buồn nôn, nôn ói, chóng mặt, đau bụng, tiêu chảy, nhức đầu, trầm cảm và lú lẫn đã được báo cáo. Các triệu chứng được mô tả chỉ là thoáng qua và không có hậu quả nào nghiêm trọng.

Xử trí

Không có thuốc giải độc hiệu quả cho omeprazol và nó không bị thẩm tách. Trong trường hợp quá liều nên điều trị triệu chứng và điều trị hỗ trợ nếu cần thiết.

THÔNG TIN VỀ DƯỢC LÝ

Đặc tính dược lực học

Nhóm dược lý: Chống loét dạ dày, tá tràng; thuốc ức chế bơm proton

Mã ATC: A02BC01

Cơ chế tác dụng: Omeprazol là một thuốc ức chế đặc hiệu lên bơm proton ở tế bào thành của dạ dày, chỉ với một liều duy nhất 20 mg omeprazol mỗi ngày tạo được sự ức chế sự tiết acid dạ dày mạnh và hiệu quả. Omeprazol là một bazơ yếu và được chuyển đổi thành dạng có hoạt tính trong môi trường có tính acid cao ở tế bào thành dạ dày, ở đó thuốc có tác dụng ức chế enzym H⁺K-ATPase - còn gọi là bơm proton.

Tác dụng lên sự tiết acid

Uống liều đơn omeprazol mỗi ngày có tác dụng ức chế nhanh chóng và hiệu quả lên sự tiết acid ngày và đêm với tác dụng tối ưu đạt được trong vòng 4 ngày điều trị. Với liều omeprazol 20 mg, sự giảm tiết acid trong dạ dày trong vòng 24 giờ trung bình thấp nhất 80% được duy trì ở những bệnh nhân loét tá tràng, sự tiết acid tối đa sau khi kích thích bằng pentagastrin giảm khoảng 70% sau 24 giờ uống thuốc. Liều uống omeprazol 20 mg duy trì pH trong dạ dày ≥ 3 trong thời gian trung bình 17 giờ ở những bệnh nhân loét tá tràng.

Do làm giảm tiết acid cũng như làm giảm độ acid trong dạ dày, omeprazol làm giảm hoặc bình thường hóa và phụ thuộc vào liều của sự tiếp xúc của thực quản với acid ở bệnh nhân bị bệnh trào ngược dạ dày - thực quản. Sự ức chế tiết acid có liên quan đến điện tích dưới đường cong nồng độ trong huyết tương theo thời gian của omeprazol và không liên quan đến nồng độ trong huyết tương thực tế tại bất cứ thời điểm nào.

Không có hiện tượng quen thuốc nào được ghi nhận

trong quá trình điều trị bằng omeprazol.

Tác dụng lên vi khuẩn *Helicobacter pylori*

Vi khuẩn *Helicobacter pylori* có liên quan với bệnh loét tiêu hóa, bao gồm loét dạ dày và loét tá tràng, là yếu tố chính gây ra viêm dạ dày và với acid dạ dày là những yếu tố chủ yếu làm loét tiêu hóa. *Helicobacter pylori* còn là tác nhân chủ yếu gây ra viêm teo dạ dày có liên quan đến tăng nguy cơ gây ung thư dạ dày. Điều trị triệt căn *Helicobacter pylori* với omeprazol và thuốc kháng sinh giúp làm lành nhanh chóng các vết loét tiêu hóa.

Phác đồ điều trị phối hợp hai thuốc trong điều trị viêm loét dạ dày, tá tràng do vi khuẩn *Helicobacter pylori* đã được chứng minh là có hiệu quả kém hơn phác đồ điều trị phối hợp ba thuốc. Tuy nhiên, có thể cần nhắc sử dụng phác đồ điều trị phối hợp hai thuốc ở những trường hợp bị quá mẫn dẫn đến không thể sử dụng bất kỳ phác đồ điều trị phối hợp ba thuốc nào.

Các tác dụng khác liên quan đến sự ức chế tiết acid

Đã có ghi nhận về tăng tần suất u nang tuyến dạ dày ở những bệnh nhân dùng omeprazole dài hạn, những thay đổi này là hậu quả về sinh lý của sự ức chế tiết acid, lành tính và có thể hồi phục được.

Giảm độ acid dạ dày do bất kỳ thuốc nào kể cả các thuốc ức chế bơm proton làm tăng số lượng vi khuẩn trong dạ dày mà các vi khuẩn này bình thường vào ruột đến trong ống tiêu hóa. Điều trị bằng thuốc giảm acid có thể dẫn đến tăng nhẹ nguy cơ nhiễm khuẩn đường tiêu hóa như *Salmonella* và *Campylobacter*, và ở những bệnh nhân nhập viện, cũng có thể nhiễm *Clostridium difficile*. Gastrin trong huyết thanh tăng lên đáp ứng với sự giảm tiết acid đã được ghi nhận trong quá trình điều trị với thuốc chống tăng acid. CgA cũng tăng lên do giảm độ acid dạ dày. Nồng độ CgA tăng lên có thể ảnh hưởng đến các xét nghiệm khối u thần kinh nội tiết, do đó bệnh nhân nên ngừng các thuốc ức chế bơm proton từ 5 ngày đến 2 tuần trước khi xét nghiệm CgA. Điều này cho phép nồng độ CgA trở về khoảng tham chiếu nếu nồng độ này bị tăng giả do điều trị bằng PPI.

Số lượng các tế bào ECL tăng lên có thể có liên quan đến sự gia tăng gastrin trong huyết thanh, điều này đã được ghi nhận ở một số bệnh nhân (cả trẻ em và người lớn) trong quá trình điều trị lâu dài bằng omeprazol. Những phát hiện này được xem là không có ý nghĩa lâm sàng.

Đặc tính dược động học

Hấp thu

Omeprazol là chất kém bền với acid, vì vậy thuốc được dùng theo đường uống dưới dạng viên nén hoặc viên nang cứng chứa cốm hoặc vi hạt tan trong ruột. Omeprazol được hấp thu nhanh chóng, đạt nồng độ đỉnh trong huyết tương trong vòng 1-2 giờ sau khi uống. Omeprazol được hấp thu hoàn toàn ở ruột non sau khi uống từ 3 đến 6 giờ. Đồng thời với việc ức chế ảnh hưởng lên sinh khả dụng của thuốc. Sinh khả dụng của omeprazol sau khi uống một liều đạt khoảng 40%. Sinh khả dụng tăng lên 60% sau khi dùng liều lặp lại một lần/ngày.

Phân bố

Thể tích phân bố biểu kiến khoảng 0,3 l/kg cân nặng. Omeprazol gắn với protein huyết tương khoảng 97%.

Chuyển hóa

Omeprazol bị chuyển hóa hoàn toàn bởi hệ enzym cytochrom P450, chủ yếu bởi CYP2C19, có vai trò trong sự tạo thành hydroxyomeprazol, là chất chuyển hóa chính trong huyết tương. Phần còn lại omeprazol bị chuyển hóa bởi cytochrom CYP3A4 tạo thành omeprazol sulphon. Do omeprazol có ái lực mạnh với CYP2C19, có nguy cơ ức chế cạnh tranh và tương tác giữa thuốc và chất chuyển hóa của thuốc với các cơ chất khác của CYP2C19. Tuy nhiên, do có ái lực thấp với CYP3A4, omeprazol không có khả năng ức chế sự chuyển hóa của các cơ chất của CYP3A4. Hơn nữa, omeprazol không có tác dụng ức chế trên các enzym CYP chính. Khoảng 3% người da trắng và 15 - 20% người châu Á thiếu enzym CYP2C19 và được gọi là những người chuyển hóa kém. Ở những người này, sự chuyển hóa omeprazol có thể được xúc tác chủ yếu bởi CYP3A4. Sau khi sử dụng liều lặp lại omeprazol 20 mg 1 lần mỗi ngày, diện tích dưới đường cong (AUC) trung bình ở người chuyển hóa kém cao hơn từ 5 đến 10 lần so với những đối tượng có enzym CYP2C19 với chức năng đầy đủ (người chuyển hóa bình thường). Nồng độ đỉnh trung bình cũng cao hơn khoảng 3 đến 5 lần. Những phát hiện này không ảnh hưởng đến liều dùng của omeprazol.

Thải trừ

Thời gian bán thải của omeprazol trong huyết tương thường ngắn hơn 1 giờ, cả khi dùng liều đơn hoặc liều lặp lại một lần/ngày. Omeprazol bị thải trừ hoàn toàn ra khỏi huyết tương giữa các liều mà không gây ra tích lũy thuốc. Khoảng 80% của một liều uống bị thải trừ trong nước tiểu dưới dạng chất chuyển hóa, phần còn lại thải trừ trong phần chủ yếu bởi bài tiết qua mật. Các chất chuyển hóa không có bất kỳ tác dụng nào lên sự tiết acid dạ dày.

Dược động học ở các đối tượng đặc biệt

Bệnh nhân suy gan

Sự chuyển hóa omeprazol ở những bệnh nhân rối loạn chức năng gan bị suy giảm, dẫn đến gia tăng diện tích dưới đường cong. Omeprazol không thể hiện khuynh hướng tích lũy khi dùng liều 1 lần/ngày.

Bệnh nhân suy thận

Dược động học của omeprazol, kể cả sinh khả dụng toàn thân và tốc độ thải trừ đều không đổi ở những bệnh nhân bị suy giảm chức năng thận.

Người cao tuổi

Tốc độ chuyển hóa của omeprazol bị giảm ở người cao tuổi (75 - 79 tuổi).

Trẻ em

Trong quá trình sử dụng omeprazol ở liều điều trị cho trẻ em từ 1 tuổi trở lên, nồng độ trong huyết tương ở trẻ em tương tự với người lớn. Ở những trẻ dưới 6 tháng tuổi, độ thanh thải omeprazol thấp do khả năng chuyển hóa omeprazol thấp.

QUICK CÁCH DÙNG GÓI

- Hộp chứa 2 vỉ x 10 viên nang cứng
- Hộp chứa 10 vỉ x 10 viên nang cứng

ĐIỀU KIỆN BẢO QUẢN, HẠN DÙNG, TIÊU CHUẨN CHẤT LƯỢNG

Điều kiện bảo quản: Giữ thuốc ở nơi khô ráo, nhiệt độ dưới 30°C. Tránh ánh sáng.

Hạn dùng: 36 tháng kể từ ngày sản xuất

Tiêu chuẩn chất lượng: Tiêu chuẩn cơ sở

TÊN VÀ ĐỊA CHỈ CƠ SỞ SẢN XUẤT THUỐC

MEDOCHEM LTD - CENTRAL FACTORY

1-10 Constantinoupolis street, 3011 Limassol, Cộng hòa Síp.