

Esoprex

Esomeprazole USP

Presentation:

Esoprex 20 Capsules: Each capsule contains Esomeprazole Magnesium Trihydrate USP (as enteric coated pellets) equivalent to Esomeprazole 20 mg.

Esoprex 40 Capsules: Each capsule contains Esomeprazole Magnesium Trihydrate USP (as enteric coated pellets) equivalent to Esomeprazole 40 mg.

Esoprex Injection: Each vial contains Esomeprazole Sodium INN equivalent to Esomeprazole 40 mg (as lyophilized powder).

Properties and effects

Esomeprazole is a proton pump inhibitor that suppresses gastric acid secretion by specific inhibition of the H⁺/K⁺ ATPase, the 'Proton Pump' of the gastric parietal cell.

Indication:

Esomeprazole is indicated

- To relieve from chronic heartburn symptoms and other symptoms associated with GERD
- For the healing of erosive esophagitis
- For maintenance of healing of erosive esophagitis
- In combination with amoxicillin and clarithromycin for eradication of *Helicobacter pylori* infection in-patients with duodenal ulcer disease.
- Zollinger-Ellison Syndrome
- Acid related Dyspepsia
- Duodenal & Gastric ulcer

Pharmacokinetics:

Absorption

Esomeprazole capsules contain an enteric-coated pellet formulation of esomeprazole magnesium. After oral administration peak plasma levels (C_{max}) occur at approximately 1.5 hours (T_{max}). The C_{max} increases proportionally when the dose is increased, and there is a three-fold increase in the area under the plasma concentration-time curve (AUC) from 20 to 40 mg. At repeated once daily dosing, the systemic bioavailability is approximately 90% compared to 64% after a single dose. The AUC after administration of a single dose of esomeprazole is decreased by 33-53% after food intake compared to fasting conditions. Esomeprazole should be taken at least one hour before meals.

Distribution

Esomeprazole is 97% bound to plasma proteins. Plasma protein binding is constant over the concentration range of 2-20 μmol/L. The apparent volume of distribution at steady state in healthy volunteers is approximately 16 L.

Metabolism

Esomeprazole is extensively metabolised in the liver by the cytochrome P450 (CYP) enzyme system. The metabolites of esomeprazole lack antisecretory activity. The major part of esomeprazole's metabolism is dependent upon the CYP2C19 isoenzyme, which forms the hydroxy and desmethyl metabolites. The remaining amount is dependent on CYP3A4 which forms the sulphone metabolite.

Excretion

The plasma elimination half-life of esomeprazole is approximately 1–1.5 hours. Less than 1% of parent drug is excreted in the urine. Approximately 80% of an oral dose of esomeprazole is excreted as inactive metabolites in the urine, and the remainder is found as inactive metabolites in the faeces.

Combination Therapy with Antimicrobials

Esomeprazole magnesium 40 mg once daily is given in combination with clarithromycin 500 mg twice daily and amoxicillin 1000 mg twice daily for 7 days. The mean steady state AUC and C_{max} of Esomeprazole increased by 70% and 18%, respectively, during triple combination therapy compared to treatment with Esomeprazole alone.

The pharmacokinetic parameters for clarithromycin and amoxicillin are similar during triple combination therapy and administration of each drug alone. However, the mean AUC and C_{max} for 14-hydroxyclarithromycin are increased by 19% and 22%, respectively, during triple combination therapy compared to treatment with clarithromycin alone. This increase in exposure to 14-hydroxyclarithromycin is not considered to be clinically significant.

Dosage & Administration

Esomeprazole capsules should be swallowed whole and taken one hour before meal. Healing of Erosive Esophagitis: 20 mg or 40 mg Once Daily for 4-8 Weeks. The majority of patients are healed within 4 to 8 weeks. For patients who don't heal after 4-8 weeks, an additional 4-8 weeks of treatment may be considered. Maintenance of Healing of Erosive Esophagitis: 20 mg Once Daily (Clinical studies did not extend 6 months). Symptomatic GERD: 20 mg Once Daily for 4 Weeks. If symptoms do not resolve completely after 4 weeks, an additional 4 weeks of treatment may be considered. *Helicobacter Pylori* eradication: Triple Therapy to reduce the risk of Duodenal Ulcer recurrence-Esomeprazole 40 mg Once Daily for 10 days, Amoxicillin 1000 mg Twice Daily for 10 days, Clarithromycin 500 mg Twice Daily for 10 days. Zollinger-Ellison Syndrome: The dose is 20-80 mg once daily. The dosage should be adjusted individually and treatment continued as long as clinically indicated. Acid related Dyspepsia: 20-40 mg once daily for 2-4 weeks according to response. Duodenal ulcer: 20 mg once daily for 2-4 weeks. Gastric ulcer: 20-40 mg once daily for 4-8 weeks.

Contraindication

Esomeprazole is contraindicated in-patient with known hypersensitivity to any of the formulation.

Precaution

General

Symptomatic response to therapy with esomeprazole does not preclude the presence of gastric malignancy.

Information for patients

Esomeprazole capsules should be taken at least one hour before meals. For patients who have difficulty swallowing capsules, one tablespoon of applesauce can be added to an empty bowl and the Esomeprazole capsules can be opened, and the pellets inside the capsule carefully emptied onto the applesauce. The pellets should be mixed with the applesauce and then swallowed immediately. The applesauce used should not be hot and should be soft enough to be swallowed without chewing. The pellets should not be chewed or crushed. The pellet/applesauce mixture should not be stored for future use. Antacids may be used while taking esomeprazole.

Pregnancy

There are no adequate and well-controlled studies in pregnant women. Animal

studies have revealed no teratogenic effects.

Nursing Mothers

The excretion of esomeprazole in milk has not been studied. Breast-feeding should be therefore discontinued if the use of esomeprazole is considered essential.

Paediatric Use

Safety and effectiveness in paediatric patients have not been established.

Geriatric Use

No overall differences in safety and efficacy have been observed between the elderly and younger individuals, and other reported clinical experience has not identified differences in responses between the elderly and younger patients, but greater sensitivity of some older individuals can not be ruled out.

Hepatic Insufficiency

No dosage adjustment is recommended for patients with mild to moderate hepatic insufficiency. However, in-patients with severe hepatic insufficiency a dose of 20 mg once daily should not be exceeded.

Renal Insufficiency

The Pharmacokinetics of Esomeprazole in patients with renal impairment are not expected to be altered relative to healthy volunteers as less than 1% of Esomeprazole is excreted unchanged in urine.

Undesirable effects

The most frequently occurring adverse events reported with Esomeprazole include headache, diarrhoea, nausea, flatulence, abdominal pain, constipation and dry mouth. There are no difference in types of related adverse events seen during maintenance treatment upto 12 months compared to short term treatment.

Drug Interaction:

Esomeprazole is extensively metabolized in the liver by CYP2C19 and CYP3A4. In vitro and in vivo studies have shown that Esomeprazole is not likely to inhibit CYPs 1A2, 2A6, 2C9, 2D6, 2E1 and 3A4. No clinically relevant interactions with drugs metabolized by these CYP enzymes would be expected. Drug interaction studies have shown that Esomeprazole does not have any clinically significant interactions with phenytoin, warfarin, quinidine, clarithromycin or amoxicillin. Esomeprazole may potentially interfere with CYP2C19, the major Esomeprazole metabolising enzyme. Co-administration of Esomeprazole 30 mg and diazepam, a CYP2C19 substrate has resulted in a 45% decrease in clearance of diazepam. Increased plasma levels of diazepam have been observed 12 hours after dosing and onwards. Esomeprazole inhibits gastric acid secretion. Therefore, Esomeprazole may interfere with the absorption of drugs where gastric pH is an important determinant of bioavailability (e.g., ketoconazole, iron salts and digoxin). Co-administration of oral contraceptives, diazepam, phenytoin, or quinidine do not seem to change the pharmacokinetic profile of Esomeprazole.

Combination Therapy with Clarithromycin

Co-administration of esomeprazole, clarithromycin, and amoxicillin has resulted in increases in the plasma levels of esomeprazole and 14-hydroxyclarithromycin.

Overdose

A single oral dose of Esomeprazole at 510 mg/kg (about 103 times the human dose on a body surface area basis), has been lethal to rats. The major signs of acute toxicity are reduced motor activity, changes in respiratory frequency, tremor, ataxia, and intermittent clonic convulsions. There have been no reports of overdose with Esomeprazole.

No specific antidote for Esomeprazole is known. Since Esomeprazole is extensively protein bound, it is not expected to be removed by dialysis. In the event of overdose, treatment should be symptomatic and supportive. As with the management of any overdose, the possibility of multiple drug ingestion should be considered.

Injection

GERD with Erosive Esophagitis: Adults: Dose is either 40 mg Esomeprazole given once daily by intravenous injection (not less than 3 minutes) or intravenous infusion (10 minutes to 30 minutes).

Pediatric: Give the following doses once daily as an intravenous infusion over 10 minutes to 30 minutes.

1 year to 17 years: Body weight less than 55 kg: 10 mg

Body weight 55 kg or greater: 20 mg

1 month to less than 1 year of age: 0.5mg/kg

Directions for reconstitution of solution

Solution for injection is prepared by adding 5 ml of 0.9% sodium chloride for intravenous injection into the vial containing the dry powder. The reconstituted solution for injection is clear and colorless to very slightly yellow.

Administration

IV injection must be administered intravenously over a period of at least 3 minutes. Prepared solution must be used within 12 hours of preparation and can be exposed to normal indoor lighting at a maximum of 30°C.

Geriatric: No dosage adjustment is necessary/ Renal insufficiency: No dosage adjustment is necessary. Hepatic Insufficiency: No dosage adjustment is necessary in patients with mild to moderate liver impairment. For patients with severe liver impairment, a dose of 20 mg of Esoprex Should not be exceeded.

Storage condition

Store in a cool (below 30°C) and dry place, away from light. Keep out of the reach of children.

Commercial Pack

Esoprex 20 Capsules: Each box contains 100 capsules (10 x 10's) in Alu-Alu blister pack.

Esoprex 40 Capsules: Each box contains 30 capsules (3 x 10's) in Alu-Alu blister pack.

Esoprex Injection: Each box contains 1 vial of Esomeprazole 40 mg injection (as lyophilized powder), 1 ampoule of 5 ml 0.9% sodium chloride USP injection and 1 sterile disposable 5 ml syringe.

Manufactured By

BEACON[®]
Pharmaceuticals PLC

Bhaluka, Mymensingh, Bangladesh

ইসোপ্রেস

ইসোমিপ্রাজল ইউএসপি

উপস্থাপনা:

ইসোপ্রেস ২০ ক্যাপসুল: প্রতিটি ক্যাপসুলে আছে ইসোমিপ্রাজল ম্যাগনেসিয়াম ট্রাইহাইড্রেট ইউএসপি (এন্টেরিক কোটেড পিলেট হিসেবে) যা ইসোমিপ্রাজল ২০ মিগ্রা এর সমতুল্য।

ইসোপ্রেস ৪০ ক্যাপসুল: প্রতিটি ক্যাপসুলে আছে ইসোমিপ্রাজল ম্যাগনেসিয়াম ট্রাইহাইড্রেট ইউএসপি (এন্টেরিক কোটেড পিলেট হিসেবে) যা ইসোমিপ্রাজল ৪০ মিগ্রা এর সমতুল্য।

ইসোপ্রেস ইনজেকশন: প্রতিটি ভায়েলে রয়েছে ইসোমিপ্রাজল সোডিয়াম আইএনএন যা ইসোমিপ্রাজল ৪০ মিগ্রা এর সমতুল্য লায়োফাইজড পাউডার।

বৈশিষ্ট্য ও গুণাগুণ:

ইসোমিপ্রাজল সুনিদ্রিতভাবে গ্যাস্ট্রিক প্যারাইটাল কোষে অবস্থিত প্রোটিন পাশ্চ প্রতিরোধক। এটি এনজাইম কে নিগ্রহ করার মাধ্যমে মাত্রা নির্ভর এসিড নিঃসরণ বিরোধী কার্যক্রম শুরু করে।

রোগ নির্দেশনা:

গ্যাস্ট্রো ইসোফেগাল রিফ্লাক্স রোগ, ইরোসিভ ইসোফেগাইটিস রোগসমূহ নির্মূলে নির্দেশিত। এছাড়াও ডিওডেনাল আলসারে হ্যালিকবেক্টার পাইলোরী নির্মূলে (ট্রিপল থেরাপি) ইসোমিপ্রাজল ব্যবহৃত হয়। এসিড সম্পর্কিত ডিসপেপসিয়া, ডিওডেনাল অথবা গ্যাস্ট্রিক আলসার এবং জলিঞ্জার-ইলিশন সিনড্রোম এর চিকিৎসায় এটি ব্যবহৃত হয়।

মাত্রা ও প্রয়োগবিধি:

ইসোমিপ্রাজল বাওয়ার ১ ঘন্টা পূর্বে সেবন করা উচিত। রোগের ধরণ অনুযায়ী সুপারিশকৃত মাত্রা ও প্রয়োগ নিম্নরূপ:

- ইরোসিভ ইসোফ্যাগাইটিস নির্মূলে ২০/৪০ মিগ্রা হিসাবে দৈনিক ১ বার করে ৪-৮ সপ্তাহ। অধিকাংশ ক্ষেত্রেই ৪-৮ সপ্তাহেই রোগ নির্মূল সম্ভব। তবে কোন কোন ক্ষেত্রে অতিরিক্ত ৪-৮ সপ্তাহকাল চিকিৎসার প্রয়োজন হতে পারে।
- ইরোসিভ ইসোফ্যাগাইটিস নিরাময় নিয়ন্ত্রণে ২০ মিগ্রা করে দৈনিক ১ বার, ৬ মাসের অধিক সময়কালের ক্ষেত্রে প্রয়োজ্য নয়।
- লক্ষণ নির্ভর গ্যাস্ট্রোইসোফেগাল রোগ সমূহের ক্ষেত্রে ২০ মিগ্রা হিসেবে দৈনিক ১ বার করে ৪ সপ্তাহ।
- ডিওডেনাল আলসারে হ্যালিকবেক্টার পাইলোরী নির্মূলে ট্রিপল থেরাপী
ইসোমিপ্রাজল ৪০ মিগ্রা দৈনিক ১ বার ১০ দিন
এমোপ্লিসিলিন ১০০০ মিগ্রা দৈনিক ২ বার ১০ দিন
ক্লারিথ্রোমাইসিন ৫০০ মিগ্রা দৈনিক ২ বার ১০ দিন
- জলিঞ্জার ইলিশন সিনড্রোমে ইসোমিপ্রাজল ক্যাপসুলের দৈনিক একক প্রয়োগ মাত্রা ২০-৮০ মিগ্রা, রোগীর বৈশিষ্ট অনুযায়ী প্রয়োগ মাত্রা নির্ধারণ করতে হবে এবং ক্লিনিক্যাল নির্দেশনা যতদিন থাকবে ততদিন চিকিৎসা চালিয়ে যেতে হবে।
- ডিওডেনাল আলসারের ক্ষেত্রে দৈনিক ২০ মিগ্রা হিসাবে ২-৪ সপ্তাহ।
- গ্যাস্ট্রিক আলসারের ক্ষেত্রে দৈনিক ২০-৪০ মিগ্রা হিসাবে ৪-৮ সপ্তাহ।

প্রতিনির্দেশনা:

ইসোমিপ্রাজলের প্রতি অতিসংবেদনশীল রোগীর ক্ষেত্রে এর ব্যবহার পরিহার করা উচিত

সাবধানতা:

ইসোমিপ্রাজল গ্যাস্ট্রিক আলসারে ব্যবহারের পূর্বে অবশ্যই ম্যালিগন্যান্স-নির সন্ধ্যাব্যতা যাচাই করে নিতে হবে। তা না হলে ইসোমিপ্রাজল রোগের লক্ষণসমূহকে ঢেকে দিয়ে রোগ নিরূপণে বিলম্ব ঘটতে পারে।

গর্ভাবস্থায় ও স্তন্যদানকালে ব্যবহার:

গর্ভাবস্থায় নিরাপদ ব্যবহারের কোনো নির্দেশনা এখনও প্রতিষ্ঠিত হয়নি। তবে জীব জন্তুর উপর পরীক্ষা করে কোন বিকলাঙ্গজিনিত ফলাফল পাওয়া যায়নি। যেহেতু মাতৃদুগ্ধে ইসোমিপ্রাজলের নিঃসরণ সন্ধ্যাজাত শিশুর উপর এর প্রভাবজনিত কোন তথ্য পাওয়া যায়নি তাই ইসোমিপ্রাজল দিয়ে চিকিৎসাকালে স্তন্যদান সাময়িক বন্ধ রাখতে হবে।

শিশুদের ক্ষেত্রে:

কার্যকারিতা ও নিরাপত্তা এখনও প্রতিষ্ঠিত হয়নি।

বয়স্কদের ক্ষেত্রে:

মাত্রা নিয়ন্ত্রণের প্রয়োজন নেই।

যকৃতের গোলযোগ:

যকৃত ক্রিয়ায় গোলযোগের ক্ষেত্রে ওষুধের জৈবভাভ্যতা

(Bioavailability) এবং অর্ধ জীবন (half-life) বেড়ে যেতে পারে তাই সেক্ষেত্রে মাত্রা নির্ধারণের প্রয়োজন রয়েছে এবং এতে সর্বোচ্চ প্রয়োগ মাত্রা হবে দৈনিক ২০ মিগ্রা।

মুত্র গোলযোগ:

এ সকল ক্ষেত্রে মাত্রা নিয়ন্ত্রণের প্রয়োজন নেই।

পার্শ্ব প্রতিক্রিয়া:

মৃদু ও অসহ্যী পার্শ্বপ্রতিক্রিয়ার মধ্যে রয়েছে মাথাব্যথা, ডায়রিয়া, বমি বমি ভাব, তলপটে ব্যথা, কোষ্ঠ কাঠিগা ইত্যাদি।

মিথক্রিয়া:

ইসোমিপ্রাজল ব্যবহারের সময় ফেনিটয়ন, ওয়ারফেরিন, কুইনিডিন, ক্লারিথ্রোমাইসিন, এমোপ্লিসিলিন এর মিথক্রিয়া কোনো প্রমাণ নাই তবে ডায়াজিপামের নিঃসরণ প্রতিক্রিয়া বিলম্ব হতে পারে। ইসোমিপ্রাজল কিতোকোলাজল, ডিগোজিন এবং সৌহ জাতীয় ওষুধের শোষণের ক্ষেত্রে বাধা সৃষ্টি করতে পারে।

ইনজেকশন

গ্যাস্ট্রো ইসোফেজিয়াল রিফ্লাক্স ডিজিজ ও ইরোসিভ ইসোফেজাইটিস নিরাময়ে:

বয়স্ক: ইনজেকশন (কমপক্ষে ৩ মিনিট ধরে) হিসেবে প্রতিদিন ৪০ মিগ্রা ইসোমিপ্রাজল দিতে হবে।

পেডিয়াট্রিক: প্যারেনটেরাল ইনফিউশন হিসেবে দিতে হবে (কমপক্ষে ১০ থেকে ৩০ মিনিট ধরে নিম্নোক্ত উপায়ে-

১ থেকে ১৭ বছর:

শরীরের ওজন ৫৫ কেজি বা এর চেয়ে কম হলে: ১০ মিগ্রা

শরীরের ওজন ৫৫ কেজি বা এর চেয়ে বেশি হলে: ২০ মিগ্রা

১ মাস থেকে ১ বছরের কম বয়স: ০.৫ মিগ্রা/কেজি শরীরের ওজন প্রতিদিন

সলুউশন তৈরীর নিয়মাবলী

ভায়ালের ইসোমিপ্রাজলে ৫ মিলি সোডিয়াম ক্লোরাইড দ্রবণ মিশিয়ে ইউট্রোসোস ইনজেকশন ব্যবহার উপযোগী দ্রবণ তৈরী করতে হবে। প্রস্তুতকৃত দ্রবণ পরিষ্কার বর্ণবিহীন থেকে হালকা হলুদ বর্ণের রঙ ধারণ করতে পারে।

ব্যবহার বিধি

আইভি ইনজেকশন অবশ্যই শিরাপথে কমপক্ষে ৩ মিনিট ধরে প্রবেশ করাতে হবে। প্রস্তুতির ১২ ঘন্টার মধ্যে অবশ্যই ইনজেকশন ব্যবহার করে শেষ করতে হবে। প্রস্তুতকৃত ইনজেকশন সাধারণ আলোতে ৩০° সেলসিয়াস তাপমাত্রা পর্যন্ত সংরক্ষণ করা যাবে।

বয়ঃবৃদ্ধদের জন্য: মাত্রা পুনর্নির্ধারণের প্রয়োজন নেই।

কিডনীর অসমকার্যকারিতায়: মাত্রা পুনর্নির্ধারণের প্রয়োজন নেই।

যকৃতের অসমকার্যকারিতায়: মৃদু হতে মধ্যম ধরনের অসমকার্যকারিতায় মাত্রা পুনর্নির্ধারণের প্রয়োজন নেই। যকৃতের তীব্র অসমকার্যকারিতায় ২০ মিগ্রা ইসোপ্রেস এর বেশী মাত্রা দেয়া উচিত নয়।

ওষুধ বিষয়ক সতর্কতা:

আলো থেকে দূরে, ঠান্ডা (৩০° সেলসিয়াসের নিচে) ও শুকনো স্থানে রাখুন। সকল ওষুধ শিশুদের নাগালের বাইরে রাখুন।

বাণিজ্যিক মোড়ক:

ইসোপ্রেস ২০ ক্যাপসুল: প্রতিটি বক্সে রয়েছে ইসোমিপ্রাজল ২০ মিগ্রা ১০০ টি ক্যাপসুল (১০ X ১০) অ্যালু-অ্যালু ক্লিস্টার প্যাকে।

ইসোপ্রেস ৪০ ক্যাপসুল: প্রতিটি বক্সে রয়েছে ইসোমিপ্রাজল ৪০ মিগ্রা ৩০ টি ক্যাপসুল (৩ X ১০) অ্যালু-অ্যালু ক্লিস্টার প্যাকে।

ইসোপ্রেস ইনজেকশন: প্রতিটি কন্ট্রোল্ড বক্সে রয়েছে ১ ভায়াল ইসোমিপ্রাজল সোডিয়াম আইএনএন যা ইসোমিপ্রাজল ৪০ মিগ্রা এর সমতুল্য লায়োফাইজড পাউডার, ৫ মিলি এর ১ এমসুল ০.৯% সোডিয়াম ক্লোরাইড ইউএসপি ইনজেকশন এবং ১টি স্টেরাইল ডিসপোসেবল সিরিঞ্জ (৫ মিলি)।

বিতারিত তথ্যের জন্য ইংরেজী অংশ দ্রষ্টব্য।

প্রস্তুতকারক

বীকন ফার্মাসিউটিক্যালস্ পিএলসি

ভালুকা, ময়মনসিংহ, বাংলাদেশ