

PROGASIC® 40

Esomeprazol 40 mg

COMPOSICION:

Cada cápsula contiene:

Esomeprazol40mg
(microgránulos entéricos recubiertos)
Excipientes c.s.p.....1 cápsula

FARMACOCINETICAY FARMACODINAMIA:

Biodisponibilidad: 90% con dosis repetidas. Vd: 16 L. Unión a proteínas: 97%. Metabolismo: Hepático vía enzimas CYP2C19 y 3A4 a metabolitos hidroxilo, desmetilo, y sulfonas (todos inactivos). Vm eliminación: 1,5 horas. Tiempo a concentración pico: 1,5 horas. Excreción: Orina (80%); heces (20%). El esomeprazol es un isómero del omeprazol (el isómero S), pero con un perfil farmacocinético y comportamiento farmacodinámico que lo hace más eficaz y más rápido en lo relacionado con su efecto antisecretor e inhibición de la bomba de protones.

El mecanismo de acción es similar al del esomeprazol, uniéndose de manera irreversible a la bomba de protones H⁺/K⁺ ATP, inhibiendo la enzima H⁺/K⁺-ATPasa. Es en el medio ácido de los canalículos secretorios de la célula parietal, donde se convierte en su forma activa. Como el esomeprazol es inestable en un medio ácido, se tiene que recubrir la tableta de manera especial, para entregar el principio activo al duodeno sitio de la absorción. La absorción es muy rápida y su Tiempo máximo se alcanza aproximadamente a la hora y media; su biodisponibilidad absoluta después de la primera administración de una dosis de 40 mg, es del 65%, subiendo a aproximadamente al 90 % al segundo día de tratamiento. Se sabe que tomar el esomeprazol después de los alimentos disminuye su absorción.

El esomeprazol es metabolizado completamente por el citocromo P-450. En pacientes con disfunción hepática puede alterarse, por lo cual en estos pacientes la dosis máxima a dosificar es de 20 mg al día. El esomeprazol se une en un porcentaje muy alto a las proteínas plasmáticas. La respuesta a la inhibición de la secreción del ácido se comienza a observar a la hora de su administración, y sobre el cuarto día de ingesta, la producción del ácido se disminuye ya en un 90%.

INDICACIONES TERAPEUTICAS:

El Esomeprazol esta indicado para el Reflujo gastroesofágico (esofagitis erosiva por reflujo, tratamiento preventivo a largo plazo de recaídas por esofagitis cicatrizada, tratamiento sintomático del reflujo gastroesofágico). En úlcera péptica y duodenal y en combinación para erradicar el *Helicobacter pylori* (cicatrización de la úlcera duodenal ocasionada por el *Helicobacter Pylori*; prevención de las recaídas de úlceras pépticas en los pacientes con úlceras relacionadas con el *Helicobacter Pylori*). Otros usos ya investigados: Manejo del síndrome de Zollinger-Ellison.

Tratamiento a corto plazo (4-8 semanas) de esofagitis erosiva; conservación de la resolución de los síntomas y curación de la esofagitis erosiva; tratamiento de la enfermedad de reflujo gastroesofágico sintomática; como parte de régimen multidisciplinario para la erradicación del *Helicobacter pylori* en pacientes con úlcera duodenal (activa o historia de enfermedad en los últimos 5 años).

CONTRAINDICACIONES Y ADVERTENCIAS:

Hipersensibilidad conocida al esomeprazol, benzimidazoles sustituidos o cualquier otro componente de la formulación

PRECAUCIONES:

Insuficiencia hepática (ajuste de dosis).

RESTRICCIONES DE USO DURANTE EL EMBARAZO Y LA LACTANCIA

Fertilidad: Los potenciales efectos del esomeprazol sobre la fertilidad y la reproducción fueron estimados usando los estudios de esomeprazol. El cual fue dado oralmente a ratas en dosis de 138 mg/kg/día (cerca de 56 veces la dosis humana sobre un área base de superficie corporal). No se encontró toxicidad o deformaciones sobre el desarrollo reproductivo en animales padres por esomeprazol.

• **Embarazo:** Estudios adecuados y bien controlados no han sido establecidos. Estudios teratológicos realizados en ratas con dosis hasta 280 mg/kg por día y en conejos hasta 86 mg/kg por día no han evidenciado problemas en la fertilidad o daño en el feto. Con esomeprazol. Categoría de uso en el embarazo: Categoría B de la FDA.

Lactancia: No se sabe si el esomeprazol se distribuye en la leche materna; sin embargo, concentraciones de esomeprazol fueron determinadas en la leche materna de una mujer luego de una administración oral de 20 mg. Debido al potencial de efectos indeseados serios en el infante lactante, debe considerarse el riesgo/beneficio de su empleo.

Pediatría: No se han realizado estudios apropiados en esta población; por lo tanto, la seguridad y eficacia del esomeprazol no ha sido establecida. Para cortos periodos de tratamiento de (ERGE). La seguridad y eficacia no han sido establecidas en niños menores hasta los 12 años de edad.

Adolescentes: Para cortos periodos de tratamiento de (ERGE). La seguridad y eficacia han sido establecidas en adolescentes de 12 a 17 años de edad. Geriatría: No se han documentado problemas con esomeprazol en esta población; sin embargo, la mayor sensibilidad de algunos ancianos no puede ser menospreciada.

Farmacogenética: La isoenzima CYP2C19 presenta polimorfismo en el metabolismo de esomeprazol. El 15% a 20% de asiáticos y 3% de los caucásicos carecen de CYP2C19 y son considerados metabolizadores pobres. En el estado estable, la razón del AUC en los metabolizadores pobres con el AUC en el resto de la población (metabolizadores extensos) es de aproximadamente 2.

REACCIONES ADVERSAS: Cefaleas, dolor abdominal, diarrea, flatulencia, náuseas/vómitos y estreñimiento. Reacciones Infrecuentes (incidencia < 1%): dermatitis, prurito, mareo, boca seca, ginecomastia. Cefaleas, dolor abdominal, diarrea, flatulencia, náuseas/vómitos y estreñimiento. Reacciones Infrecuentes (incidencia < 1%): dermatitis, prurito, mareo, boca seca, ginecomastia.

INTERACCIONES MEDICAMENTOSAS Y DE OTRO GENERO

La disminución de la acidez intragástrica puede aumentar o disminuir la absorción de los medicamentos cuyo mecanismo de absorción dependa de la acidez gástrica. Al igual que otros inhibidores de la secreción de ácido o antiácidos, el esomeprazol puede disminuir la absorción del ketoconazol, del itraconazol y las sales de hierro.

El esomeprazol interactúa con la CYP2C19; por lo tanto, cuando se combina con diazepam, citalopram, imipramina, clomipramina, y fenitoina, pueden aumentar las concentraciones plasmáticas de estos medicamentos.

Se ha demostrado que el esomeprazol carece de efectos clínicamente importantes sobre la farmacocinética de amoxicilina, quinidina o warfarina.

POSOLOGIA:

Las cápsulas deben tragarse enteras, con líquido, sin masticarlas ni triturarlas. Enfermedad de reflujo gastroesofágico (E.R.G.E.): Tratamiento de esofagitis erosiva por reflujo: 40 mg 1 vez al día durante 4 semanas. Para los pacientes cuya esofagitis no ha curado o presentan síntomas persistentes, se recomienda un tratamiento de 4 semanas adicionales. Tratamiento prolongado de pacientes con esofagitis curada para evitar recidivas: 20 mg 1 vez al día. Tratamiento sintomático de la enfermedad de reflujo gastroesofágico (E.R.G.E.): 20 mg 1 vez al día en pacientes sin esofagitis.

Si no se alcanza el control de los síntomas luego de 4 semanas, se debe investigar más al paciente. Luego de la resolución de los síntomas, el control de síntomas subsecuentes se puede lograr utilizando un régimen a demanda de 20 mg 1 vez al día, cuando sea necesario.

En combinación con regímenes de terapia antibacteriana apropiados para: la erradicación de *Helicobacter pylori*; curación de úlcera duodenal asociada a *Helicobacter pylori*; prevención de la recidiva de úlcera péptica en pacientes con úlcera asociada a *Helicobacter pylori*. Niños: Esomeprazol no debe ser usado en niños, ya que no hay información disponible. Insuficiencia renal: No se requiere ajustar la dosis en pacientes con insuficiencia renal. Debido a la experiencia limitada en pacientes con insuficiencia renal severa, estos pacientes deben ser tratados con cuidado. Insuficiencia hepática: No se requiere ajustar la dosis en pacientes con insuficiencia hepática leve a moderada. Para pacientes con insuficiencia hepática severa no debe excederse una dosis máxima de esomeprazol de 20 mg. Ancianos: No se requiere ajustar la dosis.

MANIFESTACIONES Y MANEJO DE LA SOBREDOSIFICACION O INGESTA ACCIDENTAL

Hasta ahora no hay experiencia con sobredosis. Los datos son limitados, pero dosis únicas de 80 mg de esomeprazol no trajeron consecuencias. No se conoce un antídoto específico. Esomeprazol se une en gran parte a las proteínas y, por lo tanto, no es fácilmente dializable. Como en cualquier caso de sobredosis, el tratamiento debe ser sintomático y deben utilizarse medidas generales de apoyo.

RECOMENDACIONES SOBRE ALMACENAMIENTO

Manténgase en un lugar fresco y seco a una temperatura menor de 30°C. Protéjase de la luz y la humedad.

PRESENTACION:

Caja conteniendo 2MM, 30,50,100 capsulas de esomeprazol 40 mg .

VIA DE ADMINISTRACION:

Oral

Fabricado por: Wexford Laboratories Pvt. Ltd., India, una empresa asociada a Wexford Laboratories, Inc. Warwick, RI - USA.

Fabricado para:

Gidaca Pharma S.R.L Rep. Dom.

9155-010324