

# ESOMEPRAZOL

## DESCRIPCIÓN DEL PRODUCTO

El esomeprazol es un isómero del omeprazol que disminuye la secreción de ácido del estómago, mediante la inhibición específica y selectiva de la bomba de protones, a nivel de las células parietales de la mucosa del estómago.

## COMPOSICIÓN

Cada cápsula contiene 20 mg y 40 mg de Esomeprazol (como Esomeprazol magnesio trihidrato).

## FARMACODINÁMICA

Esomeprazol es el isómero-S de omeprazol y reduce la secreción de ácido gástrico a través de un mecanismo de acción específico selectivo. Es un inhibidor específico de la bomba de hidrogeniones en la célula parietal (Inhibidor de bomba de protones). Ambos isómeros de omeprazol, R y S, poseen una actividad farmacodinámica similar. Esomeprazol es una base débil, que se concentra y se convierte a la forma activa en el medio extremadamente ácido de los canalículos secretores de la célula parietal, donde inhibe el enzima H<sup>+</sup>K<sup>+</sup>-ATPasa (la bomba de protones) e inhibe tanto la secreción ácida basal como la estimulada.

## INDICACIONES Y USO

Las cápsulas de Esomeprazol están indicadas en: Enfermedad por reflujo gastroesofágico (ERGE), tratamiento de la esofagitis erosiva por reflujo, control a largo plazo de pacientes con esofagitis curada para prevenir las recidivas. Tratamiento sintomático de la enfermedad por reflujo gastroesofágico (ERGE). En combinación con un régimen terapéutico antibacteriano apropiado, para la erradicación de *Helicobacter pylori* y cicatrización de la úlcera duodenal asociada a *Helicobacter pylori* y prevención de las recidivas de las úlceras pépticas en pacientes con úlceras asociadas a *Helicobacter pylori*.

## ADMINISTRACIÓN Y DOSIS RECOMENDADAS

Enfermedad por reflujo gastroesofágico (ERGE): Tratamiento de la esofagitis erosiva por reflujo: 40 mg una vez al día durante 4 semanas. Se recomienda un tratamiento adicional de 4 semanas para pacientes en los que la esofagitis no ha curado o que presentan síntomas persistentes. Control a largo plazo de pacientes con esofagitis curada para prevenir las recidivas: 20 mg una vez al día. Tratamiento sintomático de la enfermedad por reflujo gastroesofágico (ERGE): 20 mg una vez al día en pacientes sin esofagitis. Si no se ha obtenido el control de los síntomas tras cuatro semanas, se deberá reconsiderar el tratamiento. Una vez que los síntomas se han resuelto, se puede obtener el control posterior de los mismos empleando un régimen a demanda tomando 20 mg una vez al día, cuando sea necesario. Prevención de las recidivas de las úlceras pépticas en pacientes con úlceras asociadas a *Helicobacter pylori*. 20 mg de Esomeprazol con 1 g de amoxicilina y 500

mg de claritromicina, todos dos veces al día durante 7 días.

## FARMACOCINÉTICA

Tras la administración oral de 20 mg y 40 mg de esomeprazol, el inicio del efecto se produce en el plazo de una hora. Tras la administración repetida de 20 mg de esomeprazol una vez al día durante cinco días, la media de la secreción ácida máxima tras la estimulación con pentagastrina, determinada a las 6 - 7 horas de la administración en el quinto día, disminuye en un 90 %. En pacientes sintomáticos con ERGE, después de cinco días de tratamiento oral con 20 mg y 40 mg de esomeprazol, se mantuvo un pH intragástrico superior a 4 durante un tiempo medio de 13 y 17 horas, respectivamente, durante las 24 horas. Durante el tratamiento a largo plazo con fármacos antisecretores, se ha comunicado la aparición de quistes glandulares gástricos con una frecuencia algo mayor. Estos cambios son una consecuencia fisiológica de la marcada inhibición de la secreción ácida, son benignos y parecen ser reversibles. Esomeprazol es lábil al ácido y se administra por vía oral en forma de gránulos con recubrimiento entérico. La absorción de esomeprazol es rápida, obteniéndose niveles plasmáticos máximos aproximadamente tras 1-2 horas de la administración. La biodisponibilidad absoluta es del 64 % tras una dosis única de 40 mg y aumenta hasta el 89 % tras la administración repetida una vez al día. Esomeprazol se une en un 97 % a las proteínas plasmáticas. La ingesta de alimentos retrasa y disminuye la absorción de esomeprazol, aunque esto no influye de manera significativa en el efecto de esomeprazol sobre la acidez intragástrica. Esomeprazol es metabolizado completamente por el sistema citocromo P450 (CYP). La mayor parte del metabolismo de esomeprazol depende del polimorfo CYP2C19, responsable de la formación de los metabolitos hidroxilo y desmetil de esomeprazol. La parte restante depende de otra isoforma específica, CYP3A4, responsable de la formación de esomeprazol sulfona, el metabolito principal en plasma. La vida media de eliminación plasmática es aproximadamente de 1.3 horas tras la administración repetida una vez al día. Los principales metabolitos de esomeprazol no tienen efecto sobre la secreción ácida gástrica. Casi el 80 % de una dosis oral de esomeprazol se excreta como metabolitos en la orina y el resto, en las heces. En la orina se encuentra menos del 1% del fármaco original.

## CONTRAINDICACIONES

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

## ADVERTENCIAS Y PRECAUCIONES

En presencia de cualquier síntoma de alarma (por ejemplo, pérdida de peso involuntaria y significativa, vómitos recurrentes, disfagia, hematemesis o melena) y ante la sospecha o presencia de úlcera gástrica, deberá descartarse la posibilidad de un proceso maligno, ya que el tratamiento

con Esomeprazol 20 mg puede aliviar los síntomas y retrasar su diagnóstico.

**Embarazo:** No se dispone de datos clínicos sobre embarazos expuestos a esomeprazol. Se debe tener precaución cuando se prescriba a mujeres embarazadas. **Lactancia:** Se desconoce si esomeprazol se excreta en el leche humana. No se han realizado estudios en mujeres lactantes; en consecuencia, no se debe utilizar esomeprazol durante el período de lactancia. **Uso en ancianos:** no es necesario realizar un ajuste de dosis. **Uso en niños:** Esomeprazol no debe ser utilizado en niños puesto que no se dispone de datos.

## INTERACCIONES

Efectos de esomeprazol sobre la farmacocinética de otros fármacos:

La reducción de la acidez intragástrica durante el tratamiento con esomeprazol, puede aumentar o disminuir la absorción de fármacos si el mecanismo de absorción está influido por la acidez gástrica. Al igual que ocurre cuando se administra otros inhibidores de la secreción ácida o antiácidos, la absorción de ketoconazol e itraconazol puede disminuir durante el tratamiento con esomeprazol.

Esomeprazol inhibe CYP2C19, la principal enzima metabolizadora de esomeprazol. Por tanto, cuando se combina esomeprazol con fármacos metabolizados por CYP2C19, tales como diazepam, citalopram, imipramina, clomipramina, fenitoína, etc., pueden aumentar las concentraciones plasmáticas de estos fármacos y puede ser necesaria una reducción de dosis.

## EFFECTOS INDESEABLES

En programa de ensayos clínicos para esomeprazol y tras la comercialización, se han identificado o sospechado las siguientes reacciones adversas al fármaco. En ninguna se demostró una relación con la dosis. Frecuentes (>1/100, <1/10): Cefalea, dolor abdominal, diarrea, flatulencia, náusea, vómito, estreñimiento. Pocos frecuentes (>1/1.000, < 1/100): Dermatitis, prurito, urticaria, mareo, sequedad de boca. Raras (>1/10.000, <1/1.000): Reacciones de hipersensibilidad, por ejemplo, angioedema, reacción anafiláctica, aumento de las enzimas hepáticas.

## PRESENTACIONES COMERCIALES

Esomeprazol 20 mg cápsulas de liberación retardada, caja por 14 cápsulas. Esomeprazol 40 mg cápsulas de liberación retardada, caja por 14 cápsulas.



Cápsulas de liberación retardada de 20 y 40 mg

