

La solución reconstituida debe examinarse visualmente antes de administrarla para comprobar la ausencia de partículas sólidas o decoloración. La solución no debe emplearse si no es límpida. La solución reconstituida debe utilizarse en un plazo de 12 horas. No conservar a más de 30°C.

Nota: Este producto no debe administrarse por vía intramuscular.

INTERACCIONES:

Durante el tratamiento con esomeprazol, la disminución de la acidez intragástrica puede aumentar o disminuir la absorción de los medicamentos cuyo mecanismo de absorción depende de la acidez gástrica. Al igual que otros inhibidores de la secreción de ácido o antiácidos, esomeprazol puede disminuir la absorción de ketoconazol e itraconazol. El esomeprazol también inhibe la CYP2C19, la principal enzima implicada en su metabolismo, de modo que cuando esomeprazol se combina con medicamentos metabolizados por esta enzima como diazepam, citalopram, imipramina, clomipramina, fenitoína, etc, pueden aumentar las concentraciones plasmáticas de estos medicamentos y necesitarse una reducción de la dosis.

La administración concomitante de 30 mg de esomeprazol disminuyó en un 45% la depuración del diazepam, un sustrato de la CYP2C19.

La administración concomitante de 40 mg de esomeprazol produjo un aumento del 13% de las concentraciones plasmáticas mínimas de fenitoína en pacientes epilépticos.

Al introducir o suspender el tratamiento con el esomeprazol, se recomienda vigilar las concentraciones plasmáticas de fenitoína.

En voluntarios sanos, la administración concomitante de 40 mg de esomeprazol produjo un aumento del 32% del área bajo la curva de tiempo de la concentración plasmática (ABC) y una prolongación del 31% de la semivida de eliminación, pero no elevó de manera significativa las concentraciones plasmáticas de cisaprida. La ligera prolongación del intervalo QTc que se observa después de la administración de cisaprida sola no se acentuó cuando se administró una combinación de cisaprida y esomeprazol.

Se ha demostrado que esomeprazol carece de efectos clínicamente importantes sobre la farmacocinética de amoxicilina y quinidina.

La coadministración de omeprazol (40 mg una vez al día) y atazanavir (300 mg) / ritonavir (100 mg) en voluntarios sanos, produjo una reducción importante de la exposición al atazanavir (disminución de aproximadamente un 75% del ABC, C_{máx} y C_{mín}).

No se logró compensar el efecto del omeprazol en la exposición al atazanavir aumentando la dosis de éste último a 400 mg.

Los inhibidores de la bomba de protones (incluido el esomeprazol), no deben coadministrarse con el atazanavir. En un estudio clínico en el que se administraron 40 mg de esomeprazol por vía oral a pacientes tratados con warfarina, los tiempos de coagulación permanecieron dentro de los límites aceptados; sin embargo, durante la farmacovigilancia del esomeprazol oral se han registrado unos cuantos casos aislados de elevación del INR de importancia clínica con el tratamiento concomitante. Se recomienda vigilar el INR al principio y al final del tratamiento concomitante.

SOBREDOSIS:

Hasta la fecha no se tiene experiencia acerca de sobredosis deliberadas.

Si bien la información es limitada, la administración de dosis únicas de 80 mg de esomeprazol no produjo efectos anormales. Los síntomas descritos en conexión con una dosis oral de 280 mg fueron síntomas gastrointestinales y debilidad.

Dosis orales únicas de 80 mg de esomeprazol y dosis intravenosas de 100 mg no provocaron ninguna reacción. No se conoce antídoto específico. Esomeprazol se une extensamente a las proteínas plasmáticas y, en consecuencia, no es fácilmente dializable. Como en cualquier caso de sobredosis, el tratamiento deberá ser sintomático y se deberán emplear medidas generales de soporte.

Ante la eventualidad de una sobredosis, concurrir al Centro Nacional de Toxicología en Emergencias Médicas, sitio ubicado en Avda. Gral. Santos y T. Mongelos. Tel. 220 418. Asunción - Paraguay.

PRESENTACIÓN:

Caja 1 frasco ampolla con polvo liofilizado + 1 ampolla con disolvente x 5 mL.

CONSERVACIÓN

Almacenar a temperatura ambiente (inferior a 30°C).

Mantener fuera del alcance de los niños.

Venta Bajo Receta
Industria Paraguaya



Elaborado por

Laboratorio de Productos Éticos C.E.I.S.A.

Atilio Galfre Nº 151 y Calle 1 - San Lorenzo

para **Promepar S.A.**

Cap. Rivas Esq. Yvapurindy. Teléfono: 573-112.

San Lorenzo - Paraguay

D.T.: Q.F. Myriam Cabriza de Paredes.

Reg. Prof. Nº 2.837

Venta autorizada por la D.N.V.S. del M.S.P y B.S

Cert. Nº 18135-01-EF

Mofin® 40

Esomeprazol 40 mg

Polvo Liofilizado p/ Inyectable
Vía I.V.

FORMULA:

Cada frasco ampolla contiene:

Esomeprazol Sódico.....42,54 mg
(equivalente a 40 mg de esomeprazol)

Excipientes.....c.s.

Solvente:

Cada ampolla contiene:

Cloruro de Sodio p.a.....45,0 mg
Agua para Inyectables c.s.p.....5,0 mL

MECANISMO DE ACCIÓN:

Esomeprazol es el isómero S del omeprazol y reduce la secreción de ácido gástrico por un mecanismo de acción selectivo en la célula parietal. Es una base débil que se concentra y convierte en su forma activa en el entorno sumamente ácido de los canalículos secretorios de la célula parietal, donde inhibe la enzima H⁺-K⁺-ATPasa (la bomba de ácido), así como la secreción de ácido tanto basal como estimulada.

Se ha demostrado que el esomeprazol posee mayor eficacia clínica que el omeprazol. La curación de la esofagitis por reflujo con 40 mg de esomeprazol se produce en aproximadamente el 78% de pacientes tras cuatro semanas, y en el 93% después de ocho semanas. Un tratamiento de una semana con 20 mg de esomeprazol dos veces al día y los antibióticos apropiados, consigue la erradicación de H. pylori con éxito en aproximadamente el 90% de los pacientes. Tras el tratamiento de erradicación durante una semana, no es necesaria la monoterapia posterior con fármacos antisecretores para la cicatrización efectiva de la úlcera y la resolución de los síntomas en úlceras duodenales no complicadas.

FARMACOCINÉTICA:

El volumen de distribución aparente del esomeprazol en estado de equilibrio en sujetos sanos es de aproximadamente 0,22 litros/kg. Su unión a las proteínas plasmáticas es de 97%. Esomeprazol es metabolizado completamente por el citocromo P450 (CYP). La mayor parte de su metabolismo depende de la CYP2C19 polimorfa, responsable de la formación de los metabolitos hidroxilo y desmetilado del esomeprazol. El resto del metabolismo depende de otra isoforma específica, CYP3A4, responsable de la formación de sulfona de esomeprazol, que es el principal metabolito en el plasma. La depuración total del plasma es de unos 17 litros/hora después de una dosis única y de unos 9 litros/hora después de la administración repetida.

La semivida de eliminación del plasma es de aproximadamente 1.3 horas después de la administración repetida 1 vez al día. Esomeprazol es eliminado totalmente del plasma entre las dosis y no tiende a acumularse durante la administración 1 vez al día. Tras dosis repetidas de 40 mg administradas como inyecciones intravenosas, la concentración plasmática máxima media es de aproximadamente 13,6 micromol/L.

La concentración plasmática máxima media tras las correspondientes dosis orales es de aproximadamente 4,6 micromol/L. Se puede observar un aumento menor (de aproximadamente el 30%) en la exposición total tras la administración intravenosa en comparación con la administración oral. Tras la administración intravenosa de esomeprazol en perfusión de 30 minutos (40 mg, 80 mg o 120 mg) seguida de una perfusión continua (4 mg/h o 8 mg/h) durante 23,5 horas, se observa un incremento de la exposición total proporcional a la dosis. Los principales metabolitos del esomeprazol no ejercen efecto alguno sobre la secreción de ácido gástrico. Alrededor del 80% de una dosis oral de esomeprazol se elimina en forma de metabolitos en la orina, y el resto en las heces. Se recupera menos del 1% del medicamento sin modificar en la orina.

ACCION TERAPEUTICA:

Antiulceroso

INDICACIONES:

Esomeprazol para inyección y perfusión intravenosa, está indicado para el tratamiento como antisecretor gástrico cuando la vía oral no es posible, en casos como:

- Enfermedad por reflujo gastroesofágico en pacientes con esofagitis y/o síntomas graves de reflujo.
- Cicatrización de las úlceras gástricas asociadas al tratamiento con AINE.

- Prevención de las úlceras gástricas y duodenales asociadas al tratamiento con AINE en pacientes de riesgo.

POSOLOGIA:

Tratamiento antisecretor gástrico cuando la vía oral no es posible:

Los pacientes que no pueden tomar medicación por vía oral pueden ser tratados por vía intravenosa con 20 a 40 mg de esomeprazol, una vez al día.

Los pacientes con esofagitis por reflujo deben ser tratados con 40 mg una vez al día.

Los pacientes con enfermedad por reflujo tratados sintomáticamente deben ser tratados con 20 mg una vez al día.

Para la cicatrización de las úlceras gástricas asociadas al tratamiento con AINE, la dosis habitual es de 20 mg una vez al día.

Para la prevención de las úlceras gástricas y duodenales asociadas al tratamiento con AINE, los pacientes de riesgo deben ser tratados con 20 mg una vez al día.

Por lo general, la duración del tratamiento intravenoso es corta y la transferencia al tratamiento por vía oral debe realizarse lo antes posible.

MODO DE USO

*** Inyección Intravenosa**

- **Dosis de 40 mg:** La solución reconstituida debe administrarse como una inyección intravenosa durante un periodo de al menos 3 minutos.

- **Dosis de 20 mg:** Se debe administrar la solución reconstituida como una inyección intravenosa durante un periodo de aproximadamente 3 minutos.

* Perfusión

- **Dosis de 40 mg:** La solución reconstituida debe administrarse como una perfusión intravenosa durante un periodo de 10 a 30 minutos.

- **Dosis de 20 mg:** Se debe administrar la solución reconstituida como una perfusión intravenosa durante un periodo de 10 a 30 minutos.

Poblaciones especiales

Pacientes con disfunción renal: no es necesario ajustar la dosis en los pacientes con disfunción renal leve y moderada. Dado que la experiencia es limitada en los pacientes con insuficiencia renal severa, tales pacientes deben tratarse con precaución.

Pacientes con disfunción hepática: no es necesario ajustar la dosis en los pacientes con disfunción hepática leve a moderada.

En los pacientes con insuficiencia hepática severa, no debe administrarse una dosis diaria de esomeprazol superior a 20 mg.

Pacientes de edad avanzada: no es necesario ajustar la dosis en los pacientes de edad avanzada.

CONTRAINDICACIONES:

Hipersensibilidad conocida al esomeprazol, a los benzimidazoles o a cualquier otro componente de la fórmula. Al igual que otros inhibidores de la bomba de protones, el esomeprazol no debe administrarse con el atazanavir.

REACCIONES ADVERSAS:

Reacciones frecuentes: cefalea, dolor abdominal, diarrea, flatulencia, náusea/vómito, estreñimiento.

Reacciones infrecuente: dermatitis, prurito, urticaria, mareo, sequedad de boca. También muy raramente puede esperarse que con el uso del esomeprazol puedan presentarse las siguientes reacciones adversas que han sido registradas con el uso del omeprazol: parestesia, somnolencia, insomnio, vértigo, confusión mental reversible, agitación, agresividad, depresión y alucinaciones. Ginecomastia. Estomatitis y candidiasis gastrointestinal. Leucopenia, trombocitopenia, agranulocitosis y pancitopenia.

Elevación de enzimas hepáticas, encefalopatía en pacientes con una enfermedad hepática preexistente grave, hepatitis con o sin ictericia, insuficiencia hepática.

Artralgia, debilidad muscular y mialgia. Erupciones cutáneas, fotosensibilidad, eritema multiforme, síndrome de Stevens-Johnson, necrólisis epidérmica tóxica (NET), alopecia.

Malestar general, Reacciones de hipersensibilidad (por ej.: angioedema, fiebre, broncoespasmo, nefritis intersticial y choque anafiláctico).

Aumento de la sudoración, edema periférico, visión borrosa, alteración del gusto e hiponatremia.

PRECAUCIONES Y ADVERTENCIAS:

Si surge algún síntoma alarmante (por ej.: pérdida de peso considerable e involuntaria, vómito recurrente, disfgia, hematemesis o melena) y en caso de una úlcera gástrica presunta o confirmada, debe descartarse la presencia de una enfermedad maligna, ya que el tratamiento con esomeprazol puede aliviar los síntomas y retrasar su diagnóstico.

Los pacientes tratados por más de un año deben ser objeto de supervisión periódica. Al prescribir esomeprazol para erradicar *Helicobacter pylori* deben tomarse en cuenta las posibles interacciones de cada componente de la triple terapia.

Uso durante el embarazo y la lactancia

No se dispone de información clínica sobre la exposición al esomeprazol durante el embarazo. Estudios en animales con esomeprazol no han indicado efectos nocivos directos ni indirectos sobre el desarrollo embrionario o fetal. Debe tenerse cuidado al prescribir este medicamento a mujeres embarazadas. No se sabe si esomeprazol se excreta en la leche materna, por tanto no debe utilizarse durante la lactancia.

Uso en niños

No se debe administrar este medicamento a niños menores de 1 año o con un peso corporal menor de 10 kg (< 10 kg).

Efectos sobre la capacidad para conducir un vehículo o utilizar máquinas.

No es probable que esomeprazol afecte la capacidad para conducir o utilizar herramientas o máquinas.

RESTRICCIONES DE USO:

Inyección: la solución inyectable se prepara añadiendo 5 ml de solución de cloruro de sodio al 0.9% para administración intravenosa al frasco que contiene el esomeprazol.

La solución reconstituida debe administrarse por inyección I.V. durante un periodo mínimo de 3 minutos. Infusión: la solución para infusión se prepara disolviendo el contenido de 1 frasco con esomeprazol en hasta 50ml de solución de cloruro de sodio al 0.9%, o en solución de lactato Ringer para administración intravenosa.

La solución reconstituida debe administrarse por infusión I.V. durante un periodo de 10 a 30 minutos.

La solución reconstituida tanto para la inyección intravenosa como para la infusión intravenosa es límpida e incolora o de un color amarillo muy claro. En vista de que la degradación de la solución reconstituida depende en gran medida del pH, el producto debe reconstituirse únicamente con el volumen especificado de solución de cloruro de sodio al 0.9% para administración I.V.

La solución reconstituida no debe mezclarse ni administrarse conjuntamente con algún otro medicamento en el mismo equipo de infusión.