

VENTA BAJO
RECETA

 **INHIBIDOR DE LA BOMBA
DE PROTONES**

**CÁPSULAS DURAS
DE LIBERACIÓN
PROLONGADA
VIA ORAL**

Dexaprazol[®]

Dexlansoprazol

Composición

Cada cápsula dura de liberación prolongada de **Dexaprazol[®] 30** contiene:
Dexaprazol..... 30 mg.
Excipientes..... c. s.

Cada cápsula dura de liberación prolongada de **Dexaprazol[®] 60** contiene:
Dexaprazol..... 60 mg.
Excipientes..... c. s.

Mecanismo de Acción

Dexlansoprazol es el R-enantiómero del lansoprazol. Es un inhibidor de la bomba de protones (IBP), que suprime la secreción de ácido gástrico mediante la inhibición específica del sistema enzimático ATPasa H⁺/K⁺ en la superficie secretora de las células parietales gástricas, es decir que bloquea el último paso en la producción de ácido clorhídrico. El exceso de acidez gástrica se encuentra dentro de uno de los factores fundamentales en la producción de patologías como el reflujo gastroesofágico y la esofagitis erosiva. El bloqueo de la producción de ácido a nivel de las células del estómago por los inhibidores de protones como el dexlansoprazol, favorece el alivio de los síntomas y la curación.

Dexaprazol libera el contenido de sus gránulos y actúa en dos etapas distintas: en la primera evita la acción inmediata del ácido gástrico sobre el esófago, y en la segunda etapa genera una acción protectora de larga duración.

Farmacocinética

La farmacocinética del dexlansoprazol es altamente variable. La absorción es proporcional a la dosis administrada. La formulación de liberación prolongada de dexlansoprazol produce dos picos de concentración plasmática máxima, el primero 1 a 2 horas después de la administración y el segundo a las 4 a 5 horas. Se ha informado que el dexlansoprazol circula unido a las proteínas plasmáticas en el orden de 96 a 99%. El volumen de distribución ha sido estimado en 40,3 l. Se metaboliza ampliamente en el hígado por oxidación, reducción y formación subsiguiente de conjugados inactivos con sulfato, glucurónido y glutatión. El metabolismo oxidativo incluye la hidroxilación por el CYP2C19 y la oxidación a sulfona por el CYP3A4. Se ha informado mayor exposición sistémica al dexlansoprazol en individuos metabolizadores intermedios y lentos. La vida media de eliminación del dexlansoprazol es de 1 a 2 horas. No se ha informado acumulación con la administración de dosis múltiples, una vez por día. La eliminación en la orina se efectúa íntegramente en la forma de metabolitos. Luego de la administración de dexlansoprazol marcado, aproximadamente 51% de la radiactividad se eliminó en la orina y 48% en las heces. Los alimentos no modifican significativamente los efectos del dexlansoprazol.

Indicaciones

- Tratamiento curativo de todos los grados de esofagitis erosiva.
- Tratamiento de mantenimiento de la esofagitis erosiva.
- Tratamiento de la acidez asociada con la enfermedad por reflujo gastroesofágico no erosiva.

Posología

Dosis en adultos y jóvenes a partir de 18 años de edad:

- *Tratamiento curativo de la esofagitis erosiva:* Una cápsula de 60mg, una vez al día, durante 8 semanas.
- *Tratamiento de mantenimiento de la esofagitis erosiva:* Una cápsula de 30mg, una vez al día, durante 6 meses. En pacientes con esofagitis moderada a severa, la dosis de 60 mg puede ser usada.
- *Tratamiento de la enfermedad por reflujo gastroesofágico sintomática no erosiva:* Una cápsula de 30mg, una vez al día, durante 4 semanas.

Posología en poblaciones especiales

- *Insuficiencia Hepática:* No es necesario modificar la dosis en pacientes con deterioro hepático leve (clase Child-Pugh A). Se recomienda utilizar una dosis máxima de 30 mg por día en pacientes con deterioro hepático moderado (clase Child-Pugh B). Se recomienda no administrarlo a pacientes con deterioro hepático severo (clase Child-Pugh C).
- *Insuficiencia renal:* No es necesario ajustar la dosis en pacientes con insuficiencia renal.
- *Uso en ancianos:* La vida media de eliminación terminal del dexlansoprazol aumenta significativamente en sujetos geriátricos comparados con sujetos jóvenes (2.23 y 1.5 horas, respectivamente); esta diferencia no es clínicamente relevante. Sin embargo, no es necesario ajustar la dosis en pacientes ancianos.

Modo de Uso

Este producto se debe administrar por vía oral independientemente o de los alimentos. Las cápsulas deben tragarse enteras con un vaso de agua.

Contraindicaciones

Contraindicación conocida al dexlansoprazol, al lansoprazol o a cualquiera de los componentes de la fórmula. Embarazo. Lactancia. Insuficiencia hepática severa (clase Child-Pugh C). Se han informado casos de hipersensibilidad y anafilaxia con el uso de dexlansoprazol.

Reacciones Adversas

- En estudios clínicos, el dexlansoprazol fue bien tolerado y demostró un perfil de seguridad similar al visto con el lansoprazol.
- Las reacciones adversas más comunes observadas con el tratamiento fueron: diarrea, dolor abdominal, náusea, infecciones de vías aéreas superiores, vómito y flatulencia, todos ellos con una incidencia menor al 5%. La reacción adversa más común que llevó a la suspensión de dexlansoprazol fue la diarrea. Otras reacciones adversas y reacciones post-comercialización incluyen: - *Trastornos en sangre y sistema linfático:* anemia hemolítica autoinmune, púrpura trombocitopénica idiopática. - *Trastornos en oído y laberinto:* sordera. - *Trastornos oculares:* visión borrosa. - *Trastornos gastrointestinales:* edema oral, pancreatitis. - *Trastornos generales y condiciones en sitio de administración:* edema facial. - *Trastornos hepatobiliares:* hepatitis medicamentosa. - *Trastornos en el metabolismo y nutrición:* hipomagnesemia, hiponatremia. - *Trastornos en el sistema musculoesquelético:* fracturas óseas. - *Trastornos en el sistema nervioso:* accidente vascular cerebral, isquemia transitoria. - *Trastornos renales y de vías urinarias:* Insuficiencia renal aguda. - *Trastornos respiratorios, torácicos y del mediastino:* edema faríngeo, dolor de garganta. *Piel/Hipersensibilidad:* Rash generalizado, urticaria, vasculitis leucocitoclástica, hipersensibilidad, dermatitis exfoliativa, necrólisis epidérmica tóxica, síndrome Stevens-Johnson, reacción anafiláctica y choque anafiláctico.

Precauciones y Advertencias

- *Malignidad gástrica:* La desaparición de los síntomas en respuesta al dexlansoprazol no excluye la presencia de malignidad gástrica.
- *Fractura ósea:* La terapia con inhibidores de la bomba de protones (IBP) puede estar asociada con un mayor riesgo de fracturas de cadera, muñeca o columna vertebral relacionadas con osteoporosis. El riesgo de fractura fue mayor en los pacientes que recibieron dosis alta, definida como dosis múltiples diarias, y en terapia con inhibidores de la bomba de protones a largo plazo (un año o más).
- *Hipomagnesemia:* rara vez se ha reportado hipomagnesemia en pacientes tratados con IBP durante al menos tres meses (en la mayoría de los casos se ha reportado hipomagnesemia después de un año de tratamiento).

Los eventos adversos serios de la hipomagnesemia incluyen tetania, arritmias y convulsiones. En la mayoría de pacientes, el tratamiento de la hipomagnesemia requiere suplementación de magnesio y discontinuación del IBP. En los pacientes que requieren tratamientos prolongados con IBP o que utilizan un IBP con medicamentos que pueden causar hipomagnesemia tales como la digoxina o algunos diuréticos, se recomienda monitorear los niveles de magnesio antes de iniciar el tratamiento con el IBP, así como de manera periódica.

-*Clostridium difficile*: La terapia con IBP puede estar asociada con un mayor riesgo de infección por *Clostridium difficile*.

Uso durante el embarazo y la lactancia

-*Embarazo*: No existe experiencia adecuada y bien controlada en mujeres embarazadas, por lo que dexlansoprazol no debe ser administrado durante el embarazo, salvo que sea estrictamente necesario.

-*Lactancia*: Se desconoce si el dexlansoprazol se excreta en leche materna humana. Sin embargo se sabe que el lansoprazol y sus metabolitos se excretan en leche materna de ratas. Dado el potencial de carcinogénesis observada con el lansoprazol en estudios realizados en ratas, durante el tratamiento con dexlansoprazol debe evitarse la lactancia si la administración de este fármaco es necesaria para la madre.

Uso en niños: No se ha demostrado la eficacia y seguridad de este medicamento en niños

Efectos sobre la conducción de vehículos y el manejo de maquinaria

No se espera que aparezcan alteraciones que impidan la conducción y la utilización de maquinaria peligrosa con el uso de dexlansoprazol; no obstante se recomienda observar la respuesta al inicio del tratamiento.

Restricciones de Uso

Este producto se debe administrar con restricción en pacientes con antecedentes de insuficiencia hepática, osteoporosis, disminución de los niveles de magnesio en sangre, y reacciones de hipersensibilidad a fármacos.

Interacciones

-*Fármacos con farmacocinética de absorción dependiente del pH*: el dexlansoprazol puede interferir con la absorción de otros fármacos administrados por vía oral donde el pH gástrico es un determinante importante para su biodisponibilidad, como por ejemplo *ampicilina*, *digoxina*, *sales de hierro* y *ketoconazol*. -*Inhibidores de la proteasa del VIH*: la administración de dexlansoprazol con inhibidores de la proteasa del VIH, tales como el *atazanavir* y el *nelfinavir*, cuya absorción depende de un pH intragástrico ácido, no se recomienda, debido a la reducción significativa de su biodisponibilidad.

-La coadministración de *wartarina* 25 mg y dexlansoprazol 90 mg, no alteró la farmacocinética de la warfarina o del tiempo de protrombina.

-La administración concomitante del medicamento con *tacrolimus*, puede incrementar los niveles totales de este fármaco, especialmente en pacientes trasplantados quienes son metabolizadores lentos o intermedios de la CYP2C19.

La administración concomitante de dexlansoprazol con *clopidogrel* en sujetos sanos no presentó efectos clínicos de importancia sobre la exposición del metabolito activo del clopidogrel o la inhibición plaquetaria producida por el mismo. No es necesario ajustar la dosis de clopidogrel cuando se administra con las dosis autorizadas de dexlansoprazol.

Sobredosis

No ha habido reportes significativos de sobredosis de dexlansoprazol. Múltiples dosis de 120 mg de dexlansoprazol y una sola dosis de 300 mg no ocasionaron la muerte ni otros eventos adversos severos. No se espera que el dexlansoprazol sea removido de la circulación sanguínea por hemodiálisis. Si se presenta una sobredosis, el tratamiento debe ser sintomático y de apoyo.

Ante la eventualidad de una sobredosis, concurrir al hospital mas cercano, o al Centro Nacional de Toxicología, en Emergencias Médicas, sito en Avda. Gral. Santos y T. Mongelos. Tel.: (595-21) 220 418 Asunción -Paraguay.

Presentación:

Cajas conteniendo 30 cápsulas duras de liberación prolongada.

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

Mantener fuera del alcance de los niños.



ETICOS

Elaborado por **Pharma Industries S.A.**,
Calle 1 e/ Avda. Pastora Cespedes y San Antonio
San Lorenzo, Paraguay.

Para **Laboratorio de Productos ETICOS C.E.I.S.A.**
Atilío Galfre N° 151 y Calle 1 - San Lorenzo, Paraguay
Tel.: (595 21) 521 390 (R.A.) - Fax: (595 21) 521 389
laboratorio@eticos.com.py - www.eticos.com.py
D.T.: Q.F. Myriam Cabrizza de Paredes - Reg. N° 2837
Autorizado en Paraguay por la DINAVISA.

3156571-001

