

# ANTIUL<sup>®</sup>

## ESOMEPRAZOL

POLVO LIOFILIZADO PARA SOLUCIÓN INYECTABLE  
VIA DE ADMINISTRACIÓN: I.V.  
COMPRIMIDOS GASTRORRESISTENTE  
VÍA ORAL

### FORMULA:

Cada frasco ampolla con polvo liofilizado para solución inyectable contiene:

Esomeprazol Sódico eq. a Esomeprazol Base.....	40 mg
Excipientes.....	c.s.
Cada ampolla solvente x 5 ml	
Cloruro de Sodio P.A.....	45,00 mg
Agua para Inyectable.....	c.s.

Cada comprimido gastrorresistente contiene:

Esomeprazol (equiv. a 22,210 mg de esomeprazol magnésico 3H2O).....	20 mg
Excipientes.....	c.s.

### ACCIÓN TERAPÉUTICA:

"Inhibidor de la bomba de protones". Reduce la producción de ácido en el estómago.

### INDICACIONES TERAPÉUTICAS:

Para el tratamiento antisecretores gástrico cuando la vía oral no es posible, en casos como: - la enfermedad por reflujo gastroesofágico en pacientes con esofagitis y/o síntomas graves de reflujo - la cicatrización de las úlceras gástricas asociadas al tratamiento con AINE - la prevención de las úlceras gástricas y duodenales asociadas al tratamiento con AINE en pacientes de riesgo.

### CONTRAINDICACIONES:

Hipersensibilidad al principio activo esomeprazol o a otros benzimidazoles sustituidos o a cualquiera de los excipientes de este medicamento. Al igual que otros inhibidores de la bomba de protones (BP), esomeprazol no debe administrarse con atazanavir

### PRECAUCIONES Y ADVERTENCIAS:

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, deber descartarse la posibilidad de un proceso maligno, ya que el tratamiento puede aliviar los síntomas y retrasar su diagnóstico

### REACCIONES ADVERSAS / EFECTOS COLATERALES:

Durante el programa de estudios clínicos sobre el esomeprazol administrado por vía oral o intravenosa y durante la farmacovigilancia del producto oral se han identificado o sospechado las siguientes reacciones adversas. Las reacciones se clasifican por orden de frecuencia: frecuentes (incidencia > 1/100, <1/10); poco frecuentes (incidencia >1/1000, <1/100); raras (incidencia >1/10000, <1/1000), muy raras (incidencia <1/10000). Trastornos de la sangre y del sistema linfático Raros: Leucopenia, trombocitopenia. Muy raros: Agranulocitosis, pancitopenia. Trastornos del sistema inmunológico Raros: Reacciones de hipersensibilidad, p. ej., fiebre, angioedema y reacción o choque anafilácticos. Trastornos del metabolismo y de la nutrición Poco frecuentes: Edema periférico. Raros: Hiponatremia. Trastornos psiquiátricos Poco frecuentes: Insomnio. Raros: Agitación, confusión, depresión. Muy raros: Agresividad, alucinaciones. Trastornos del sistema nervioso Frecuentes: Cefalea.

Poco frecuentes: Mareo, parestesia, somnolencia. Raros: Disgeusia. Trastornos oculares Raros: Visión borrosa. Trastornos del oído y del laberinto Poco frecuentes: Vértigo. Trastornos respiratorios, torácicos y mediastínicos Raros: Broncoespasmo. Trastornos gastrointestinales Frecuentes: Dolor abdominal, estreñimiento, diarrea, flatulencia, náuseas / vómito Poco frecuentes: Boca seca. Raros: Estomatitis, candidiasis gastrointestinal. Trastornos hepatobiliares Poco frecuentes: Elevaciones de las enzimas hepáticas. Raros: Hepatitis acompañada o no de ictericia. Muy raros: Insuficiencia hepática, encefalopatía en pacientes con una enfermedad hepática preexistente. Trastornos de la piel y del tejido subcutáneo Poco frecuentes: Dermatitis, prurito, exantema, urticaria. Raros: Alopecia, fotosensibilidad. Muy raros: Eritema multiforme, síndrome de Stevens-Johnson, necrólisis epidérmica tóxica. Trastornos músculo esqueléticos, del tejido conjuntivo y óseos Raros: Artralgia, mialgia. Muy raros: Debilidad muscular. Trastornos renales y urinarios Muy raros: Nefritis intersticial. Trastornos del aparato reproductor y de la mama. Muy raros: Ginecomastia. Trastornos generales y alteraciones en el lugar de administración Raros: Malestar general, aumento de la sudación. Se han señalado casos aislados de trastornos visuales irreversibles en pacientes en estado crítico que han recibido el omeprazol (el racemato) en solución inyectable por vía intravenosa, especialmente con dosis altas, aunque no se ha establecido una relación de causa y efecto.

### INTERACCIÓN CON MEDICAMENTOS Y ALIMENTOS:

Efectos de esomeprazol sobre la farmacocinética de otros fármacos Medicamentos con absorción pH-dependiente 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 administran otros inhibidores de la secreción ácida o antídotos, la absorción de ketoconazol e itraconazol puede disminuir durante el tratamiento con esomeprazol. La co-administración de omeprazol (40 mg una vez al día) con 300 mg de atazanavir/100 mg de ritonavir a voluntarios sanos dio como resultado una reducción substancial en la exposición a atazanavir (un descenso del 75% aproximadamente en la ABC, C<sub>max</sub> y C<sub>min</sub>). El aumento de la dosis de atazanavir a 400 mg no compensó el impacto de omeprazol sobre la exposición a atazanavir. Los inhibidores de la bomba de protones (IBP), incluido esomeprazol, no deben ser co-administrados con atazanavir (ver apartado Contraindicaciones). Fármacos metabolizados por CYP2C19 Esomeprazol inhibe CYP2C19, el principal enzima metabolizador 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. La administración



oral concomitante de 30 mg de esomeprazol originó una disminución del 45% en el aclaramiento de diazepam, sustrato de CYP2C19. La administración oral concomitante de 40 mg de esomeprazol y fenitoína produjo un aumento del 13% en los niveles plasmáticos mínimos de fenitoína en pacientes epilépticos. Se recomienda monitorizar las concentraciones plasmáticas de fenitoína cuando se inicie o interrumpa el tratamiento con esomeprazol. Omeprazol (40 mg una vez al día) aumentó la Cmax y la AUC del voriconazol (un sustrato de CYP2C19) en un 15% y 41%, respectivamente. En un ensayo clínico, la administración oral concomitante de 40 mg de esomeprazol a pacientes tratados con warfarina mostró que los tiempos de coagulación permanecieron dentro del rango aceptado. Sin embargo, tras la comercialización de esomeprazol oral, durante el tratamiento concomitante se han notificado unos pocos casos aislados de elevación de INR de significación clínica. En tratamientos con warfarina u otros derivados de la cumarina, se recomienda monitorizar al inicio y al final del tratamiento concomitante con esomeprazol. En voluntarios sanos, la administración oral concomitante de 40 mg de esomeprazol y cisaprida originó un aumento del 32% en el área bajo la curva concentración plasma-tiempo (ABC) y una prolongación del 31% de la vida media de eliminación (t1/2), pero no produjo aumentos significativos en los niveles plasmáticos máximos de cisaprida. El intervalo QTc ligeramente prolongado observado tras la administración de cisaprida sola, no se prolongó más cuando se administró cisaprida en combinación con esomeprazol. Se ha demostrado que esomeprazol no presenta efectos de importancia clínica sobre la farmacocinética de amoxicilina o quinidina. Efectos de otros fármacos sobre la farmacocinética de esomeprazol. Esomeprazol es metabolizado por CYP2C19 y CYP3A4. La administración oral concomitante de esomeprazol y un inhibidor de CYP3A4, claritromicina (500 mg dos veces al día), originó una duplicación de la exposición (ABC) a esomeprazol. La administración concomitante de esomeprazol y un inhibidor combinado de CYP2C19 y CYP3A4 puede hacer aumentar la exposición de esomeprazol en más del doble. El inhibidor de CYP2C19 y CYP3A4, voriconazol, aumentó la ABC un 280%. Generalmente no es necesario ajustar la dosis en ninguna de estas situaciones. Sin embargo, debe considerarse un ajuste de dosis en pacientes con insuficiencia hepática grave y si se requiere un tratamiento a largo plazo.

#### POSOLOGÍA Y MODO DE USO:

Los pacientes que no pueden tomar medicación por vía oral pueden ser tratados por vía intravenosa con 20-40 mg 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. Método de administración Inyección 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 mitad de la solución reconstituida como una inyección intravenosa durante un periodo de aproximadamente 3 minutos. Debe desecharse la solución no utilizada. Perfusion 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 mitad de la solución reconstituida como una perfusión intravenosa durante un periodo de 10 a 30 minutos. Debe desecharse la solución no utilizada. Función renal alterada No se requiere ajuste de dosis en pacientes con alteración de la función renal. Debido a la limitada experiencia en pacientes con insuficiencia renal grave, dichos pacientes deben ser tratados con precaución. Función hepática alterada No se requiere ajuste de dosis en pacientes con alteración hepática de leve a moderada. En pacientes con alteración hepática grave, no se debe exceder de una dosis máxima diaria de 20 mg. Ancianos No se requiere ajuste de dosis en ancianos. LA DOSIS PEDIÁTRICA: Posología: 0,5 - 1 mg/kg/día. en 10-20 kg; 10 mg/día. > 20 kg; 20-40 mg/día. Cada 24 h. En > de 12 años y Adultos: 20-40 mg/24 h. La solución reconstituida debe utilizarse en un plazo de 12 horas. Si no se utiliza el contenido completo del vial reconstituido para una única dosis, debe desecharse la solución no utilizada Se ha demostrado la vida útil tras la reconstitución en términos de estabilidad físicos y químicos durante 12 horas a 30°C.

#### Contraindicado:

##### Adultos y niños mayores de 12 años

**Reflujo gastroesofágico (RGE):** Tratamiento de la esofagitis por reflujo corrosiva: 40 mg 1 vez al día durante 4 semanas. Se recomienda un tratamiento adicional de 4 semanas para los pacientes cuya esofagitis no ha cicatrizado o que presentan síntomas persistentes.

**Tratamiento preventivo a largo plazo de recaídas de esofagitis cicatrizada:** 20 mg 1 vez al día.

**Tratamiento sintomático del reflujo gastroesofágico (RGE):** 20 mg 1 vez al día en los pacientes sin esofagitis. Si no logran controlar los síntomas después de 4 semanas, deben realizarse estudios complementarios.

**En combinación con un régimen terapéutico antibacteriano para erradicar Helicobacter pylori y para:** Cicatrización de la úlcera duodenal provocada por H. pylori: 20 mg de esomeprazol con 1 g de amoxicilina y 500 mg de claritromicina, todos 2 veces al día durante 7 días. Prevención de recaídas de úlceras pépticas provocadas por H. pylori: 20 mg de esomeprazol con 1 g de amoxicilina y 500 mg de claritromicina, todos 2 veces al día durante 7 días.

**Tratamiento de síntomas gastrointestinales superiores asociados a la terapia con AINES:** 20 mg/día por 4 semanas

**Tratamiento sintomático de pirosis, disfagia, regurgitaciones, dolor epigástrico, gastritis, hernia hiatal:** 20 mg/día a corto plazo.

**Tratamiento de la dispepsia no ulcerosa:** 20 mg/día a corto plazo

**Niños:** no hay experiencia sobre el uso de esomeprazol en niños menores de 1 año.

**Disfunción renal:** no es necesario ajustar la dosis en estos pacientes, los que deben ser tratados con cuidado.

**Disfunción hepática:** no es necesario ajustar la dosis en pacientes con disfunción hepática leve a moderada. En los pacientes con disfunción hepática severa, no debe administrarse esomeprazol en dosis superiores a 20 mg.

**Pacientes:** de edad avanzada: no es necesario ajustar la dosis

#### SOBREDOSIS (SIGNOS, SÍNTOMAS, CONDUCTA Y TRATAMIENTO):

Hasta la fecha, existe una experiencia muy limitada con la ingestión de sobredosis de forma deliberada. 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

#### RESTRICCIONES DE USO:

Embarazo – lactancia

#### RECOMENDACION:

En caso de sobredosis recurrir al Centro Nacional de Toxicología en el Centro de Emergencias Médicas Av. Gral. Santos y Teodoro S. Mongelós - Tel. 204 800

#### PRESENTACION:

Caja x 1 frasco ampolla + ampolla solvente x 5 ml

Caja x 30 comprimidos gastroresistentes

Venta Bajo Receta.

Elaborado por Laboratorios Eticos C.E.I.S.A.

Atilio Gallfré N° 151 y Calle 1 - San Lorenzo - Paraguay

Director Técnico: Q.F. Myriam Cabrera de Paredes - Reg. N° 2837

PARA: SC.AVONNE INCÓCS S.A.

Santa Ana N° 431 c/Avda. España - Asunción - Paraguay

Director Técnico: Q.F. Amílcar Sena - Reg. Prof. N° 4.885

Mantener a temperatura ambiente (15 °C a 30 °C). Conservar en lugar seco.

Todo medicamento debe ser mantenido fuera del alcance de los niños.