

## NORMOGASTROL 20 MG 14 COMPRIMIDOS GASTRORRESISTENTES



Calificación: Sin calificación

**Precio**

5,95 €

5,95 €

0,23 €

[Haga una pregunta sobre este producto](#)

Fabricante: [NORMON](#)

Descripción

**ACCIÓN Y MECANISMO**

- Antiúlceras pépticas, inhibidor de la bomba de H<sup>+</sup>/K<sup>+</sup>. El pantoprazol es un benzimidazol que actúa como inhibidor específico, no competitivo e irreversible de la bomba de protones (IBP) o ATPasa H<sup>+</sup>/K<sup>+</sup>, localizada en la superficie de la célula parietal gástrica. El bloqueo de dicha bomba de protones impide la producción de ácido gástrico, tanto basal como ante un estímulo, independientemente de cuál sea este (acetilcolina, gastrina o histamina).

Pantoprazol es un profármaco con naturaleza de base débil, que tras su absorción es distribuido por el organismo, y en especial en la luz de los canalículos secretores de la célula parietal. Aquí, y en presencia de medio ácido, sufre una reacción química no enzimática dando lugar a la forma activa, un derivado sulfonamido totalmente hidrófilo, que tiende a acumularse en los canalículos y unirse a la bomba de protones mediante puentes disulfuro con los residuos de cisteína de la cadena alfa-luminal.

Debido a la formación de enlaces covalentes, la única forma que tiene la célula parietal de recuperar su actividad secretora es la síntesis de nuevas bombas, lo que supone un gran período de tiempo y explica la larga duración de los efectos de los IBP, que pueden llegar a durar hasta 4 días tras la administración de una dosis única, y a pesar de sus bajas t<sub>1/2</sub>.

Los efectos sobre la producción ácida comienzan a aparecer al cabo de 15-30 min (i.v.) o 2,5 h, y se pueden prolongar durante 24 h. En algunos estudios se ha comprobado que la secreción basal de ácido clorhídrico no se normaliza hasta 7 días después de la suspensión de pantoprazol.

## **FARMACOCINÉTICA**

Vía oral, parenteral:

El pantoprazol es un profármaco, y tras su absorción y distribución a la célula parietal, se transforma por una reacción química catalizada en medio ácido en el derivado sulfonamido activo.

Presenta una farmacocinética lineal a dosis entre 10-80 mg.

- Absorción: rápida absorción digestiva, obteniéndose una  $c_{max}$  de 1-1,5 mcg/ml (20 mg) y 1,91-2,2 mcg/ml (40 mg) al cabo de 2-2,5 h.

Presenta un pequeño efecto de primer paso hepático y su biodisponibilidad es del 77%.

Efecto de los alimentos: no afectan de forma significativa a la cantidad absorbida ( $c_{max}$ , biodisponibilidad), si bien pueden retrasar la absorción hasta 2 h.

- Distribución: alta unión a proteínas plasmáticas (98%), fundamentalmente albúmina. Su  $V_d$  es de 0,15-0,43 l/kg.

- Metabolismo: extenso metabolismo hepático mediante desmetilación (CYP2C19) dando lugar al desmetil-pantoprazol, principal metabolito que posteriormente sufre sulfatación. También sufre un metabolismo en menor medida por CYP3A4, mientras que CYP2C9 y 2D6 participan mínimamente. No se han descrito metabolitos activos.

Capacidad inductora/inhibidora enzimática: pantoprazol no presenta actividad sobre isoenzimas del citocromo P450 (como CYP1A2, 2C9, 2D6 o 2E1), ni sobre la P-gp. Tampoco parece presentar una actividad inhibidora del CYP2C19 significativa, al contrario que omeprazol o esomeprazol.

- Excreción: en orina (71%) y heces (18%), como metabolitos. La  $t_{1/2}$  es de 1 h y su  $CL_t$  0,1 l/h/kg.

Farmacocinética en situaciones especiales:

- Niños: en los ensayos realizados con pantoprazol en niños y adolescentes (5-16 años p.o.; 2-16 años i.v.) no se encontraron diferencias en la farmacocinética en comparación con adultos.

- Ancianos: los pacientes > 65 años presentan un incremento en AUC y  $c_{max}$ , si bien no parece tener importancia clínica.

- Insuficiencia renal: no se han observado diferencias farmacocinéticas significativas. Pantoprazol no se elimina de forma significativa por hemodiálisis.

- Insuficiencia hepática: los pacientes cirróticos con insuficiencia hepática leve a moderada (clases A y B de Child-Pugh) presentan un aumento del AUC de 3-5 veces y de la  $c_{max}$  de 1,3 veces, mientras que la  $t_{1/2}$  se incrementa 3-6 h.

- Farmacogenética: alrededor del 1-3% de la población caucásica y del 20% de la asiática carece del CYP2C19 funcional, considerándose metabolizadores lentos, frente a los pacientes que tienen el isoenzima y se consideran metabolizadores rápidos. En los metabolizadores lentos, el metabolismo hepático del pantoprazol se produce por el CYP3A4. Se ha observado que en estos pacientes la  $c_{max}$  aumenta un 60% y el AUC 6 veces, si bien no se han registrado repercusiones clínicas significativas, y no se han recomendado ajustes posológicos específicos.

## **INDICACIONES**

- Tratamiento a corto plazo de los síntomas del [REFLUJO GASTROESOFAGICO], como [HIPERACIDEZ GASTRICA] o regurgitación ácida en adultos.

## **POSOLOGÍA**

Administración oral:

- Adultos:

\* Reflujo gástrico: 20 mg/24 h. Normalmente se requieren 2-3 días de tratamiento para eliminar los síntomas. Si los síntomas continúan o empeoran después de 2 semanas de tratamiento, consultar con el médico.

Evitar tratamientos superiores a 4 semanas sin recomendación médica.

- Niños y adolescentes menores de 18 años:

No se ha evaluado la seguridad y eficacia.

- Ancianos: no requiere reajuste posológico.

Administración con alimentos: administrar 1 h antes de una de las comidas principales.

Olvido de dosis: tomar la siguiente dosis a la hora habitual. No duplicar la dosis en la siguiente administración.

## **POSOLOGÍA EN INSUFICIENCIA RENAL**

No requiere reajuste posológico.

## **POSOLOGÍA EN INSUFICIENCIA HEPÁTICA**

- Insuficiencia hepática leve a moderada (clases A y B de Child-Pugh): no requiere reajuste posológico.

- Insuficiencia hepática grave (clase C de Child-Pugh): dosis máxima 20 mg/24 h.

## **NORMAS PARA LA CORRECTA ADMINISTRACIÓN**

- Comprimidos gastrorresistentes: ingerir enteros con ayuda de un vaso de líquido. No deben masticarse, triturarse ni partirse.

## **CONTRAINDICACIONES**

- Hipersensibilidad a pantoprazol, a cualquier otro IBP, o a cualquier otro componente del medicamento.

## **PRECAUCIONES**

- [INFECCION DIGESTIVA]. El incremento del pH gástrico producido por los antiulcerosos podrían favorecer la colonización del aparato digestivo por determinados microorganismos patógenos, como Salmonella, Campylobacter e incluso Clostridium difficile en pacientes hospitalizados. Se recomienda realizar un diagnóstico diferencial de [COLITIS PSEUDOMEMBRANOSA] en pacientes tratados con un antiulceroso en los que aparezca diarrea grave.

- Tratamiento a largo plazo. Los antiulcerosos eliminan los síntomas relacionados con las enfermedades del ácido, que son comunes a los de procesos malignos como [CANCER DE ESTOMAGO] o [CANCER DE ESOFAGO]. Por tanto, existe el riesgo de retrasar el diagnóstico de estos procesos.

Se recomienda que los pacientes que reciban un tratamiento prolongado, superior a un año, sean sometidos a una vigilancia regular, y que se les advierta que notifiquen la presencia de otros síntomas asociados a estas neoplasias, como pérdida de peso importante e injustificada,

vómitos recurrentes, disfagia o vómitos en sangre o heces. En caso de sospecha de algún proceso digestivo grave se recomienda realizar un diagnóstico diferencial.

- [DEFICIT DE VITAMINA B12]. El aumento del pH producido por los fármacos antiulcerosos podría disminuir la absorción de la cianocobalamina, por lo que se recomienda tenerlo en cuenta en personas con bajos depósitos de esta vitamina, como en pacientes con [DESNUTRICION] o dietas vegetarianas estrictas sin suplementación es esta vitamina, o situaciones en las que podría verse reducida su absorción, como en [ALCOHOLISMO CRONICO], [SINDROME DE MALABSORCION] o situaciones que pudieran dar lugar a malabsorción, como [ENFERMEDAD INFLAMATORIA INTESTINAL] o procesos quirúrgicos mayores del aparato digestivo.

- [HIPOMAGNESEMIA]. El tratamiento con IBP se ha relacionado con la aparición de casos graves de hipomagnesemia, que podrían asociarse a [HIPOCALCEMIA]. Su frecuencia no se ha estimado, pero se considera rara. No obstante, se debe tener en cuenta la gran utilización de estos fármacos, por lo que su impacto clínico podría ser importante. La mayoría de los pacientes que presentaron hipomagnesemia estaban en tratamiento a largo plazo (al menos 3 meses y fundamentalmente 1 año).

Se recomienda monitorizar los niveles de magnesio al inicio del tratamiento y periódicamente a lo largo del mismo en pacientes en tratamiento a largo plazo con IBP, en tratamiento con digoxina o con fármacos que pudieran dar lugar a hipomagnesemia, como los diuréticos.

En caso de aparición de síntomas de hipomagnesemia, como cansancio, mareo, tetania, delirio, convulsiones o arritmia cardíaca se determinarán los niveles de magnesio. La hipomagnesemia responde a la eliminación del IBP y la administración de suplementos de magnesio.

- [OSTEOPOROSIS]. La administración de IBP a altas dosis y durante periodos prolongados de tiempo (> 1 año) se ha relacionado con un incremento del riesgo de fractura de cadera, muñeca y vertebral, especialmente en personas de edad avanzada y con factores de riesgo. Se aconseja por tanto que las mujeres con osteoporosis reciban un tratamiento y un aporte adecuado de calcio y vitamina D.

- [NEUMONIA]. El tratamiento con IBP se ha relacionado con casos de neumonía, incluyendo neumonía adquirida en la comunidad (CAP), neumonía intersticial o neumonía nosocomial. El riesgo parece ser mayor en pacientes que acaban de iniciar un tratamiento (especialmente < 2 días), más que en tratamientos de larga duración.

- Interferencias analíticas. El incremento del pH gástrico inducido por los antiulcerosos pueden incrementar los niveles plasmáticos de gastrina (que suelen volver al nivel basal a las 4 semanas de suspender el tratamiento) y de cromogranina A (CgA).

La CgA es marcador específico de tumores neuroendocrinos, por lo que los antiulcerosos podrían dar lugar a falsos positivos cuando se utilice este marcador en las pruebas diagnósticas. Por tanto, debe suspenderse cualquier antiulceroso al menos 5 días antes de la determinación de CgA. Si los niveles de CgA no se han normalizado en este periodo, la prueba deberá repetirse 14 días después de la suspensión del antiulceroso.

- [INSUFICIENCIA HEPATICA]. Pantoprazol se elimina fundamentalmente por metabolismo hepático, por lo que podría producirse una acumulación del fármaco. No obstante, tras la administración diaria no se ha observado acumulación, y de hecho no parece necesario proceder al reajuste de la posología. Se aconseja usar con precaución, especialmente en pacientes con insuficiencia hepática grave (clase C de Child-Pugh), en los que debería monitorizarse la funcionalidad hepática (niveles de transaminasas). En caso de un incremento significativo, suspender el pantoprazol.

#### **CONSEJOS AL PACIENTE**

- No suspenda el tratamiento hasta que así lo indique su médico, aunque los síntomas hayan desaparecido. Una suspensión prematura podría hacer que los síntomas reapareciesen.

- Si está en tratamiento "a demanda" (administrando cuando aparecen los síntomas), comunique a su médico y/o farmacéutico cualquier cambio en su sintomatología habitual.

- Avise a su médico acerca de los medicamentos que esté tomando.

- Informe a su médico y/o farmacéutico si presenta alguno de estos síntomas:

\* Diarrea intensa y/o persistente.

\* Pérdida de peso importante e injustificada, vómitos frecuentes, dificultad para tragar o presencia de sangre en vómitos o heces.

\* Cansancio injustificado, mareo, rigidez muscular, convulsiones o arritmias cardíacas.

- Si está en tratamiento "a demanda" (administrando cuando aparecen los síntomas), comunique a su médico y/o farmacéutico cualquier cambio en su sintomatología habitual.

- Consulte a su médico o farmacéutico si tiene más de 55 años y va a iniciar un tratamiento por primera vez con pantoprazol.

#### **ADVERTENCIAS ESPECIALES**

- Se recomienda confirmar la curación de las ulceraciones mediante endoscopia antes de suspender el tratamiento.

- Los IBP podrían enmascarar los síntomas de tumores digestivos de esófago o estómago. Se recomienda vigilar estrechamente a los pacientes tratados con un IBP durante periodos prolongados, superiores a 1 año. Si el paciente experimenta síntomas como pérdida de peso importante e injustificada, vómitos frecuentes, disfagia, hematemesis o melena, se recomienda realizar un diagnóstico diferencial.

- En caso de aparición de diarrea grave y prolongada se investigará la posible infección por Clostridium difficile.

- El tratamiento con IBP durante un periodo prolongado ha dado lugar raramente a cuadros graves de hipomagnesemia, que podría asociarse a hipocalcemia. Si el paciente experimenta síntomas como astenia, mareo, tetania, convulsiones o arritmia cardíaca se determinarán los niveles de magnesio, y en caso de hipomagnesemia se suspenderá el tratamiento y se administrará un suplemento de magnesio.

- Los antiulcerosos podrían interferir en el diagnóstico de tumores neuroendocrinos, al incrementar los niveles del marcador específico cromogranina A (CgA), dando lugar a falsos negativos. Suspender el antiulceroso al menos 5 días antes de la prueba, y si no se hubieran normalizado sus niveles, repetir la prueba a los 14 días de la suspensión.

- Monitorización:

\* Pruebas de funcionalidad hepática (transaminasas, bilirrubina) en pacientes con funcionalidad hepática grave (clase C de Child-Pugh).

\* Niveles de magnesio a nivel basal y periódicamente en pacientes tratados durante largos periodos con pantoprazol, tratados con digoxina o con fármacos que pudieran dar lugar a hipomagnesemia, como diuréticos.

#### **INTERACCIONES**

- Anticoagulantes orales. Se han descrito casos de aumentos del INR en pacientes tratados con un anticoagulante y un IBP. Se recomienda usar con precaución, monitorizando el INR.

- Clopidogrel. Se han descrito reducciones en el efecto antiagregante en pacientes que recibieron omeprazol. Pantoprazol parece no interactuar con clopidogrel, si bien se recomienda usar con precaución, monitorizando el efecto del clopidogrel.

- Fármacos con absorción dependiente de pH. El incremento del pH producido por los antiulcerosos podría modificar la absorción de determinados medicamentos, al favorecer o reducir su disolución en el medio acuoso del contenido gástrico. De tal manera se ha observado un incremento en la absorción de digoxina, así como una reducción en la de antifúngicos azólicos (itraconazol, ketoconazol, posaconazol), micofenolato mofetilo, rilpivirina, vitamina B12 e inhibidores de la tirosina-kinasa (dasatinib, erlotinib, gefitinib, lapatinib, nilotinib, pazopanib). Es rara la aparición de toxicidad por digoxina, pero ante sus graves efectos se aconseja precaución en pacientes ancianos tratados con altas dosis. Se recomienda monitorizar los niveles plasmáticos de digoxina.

- Inductores/inhibidores enzimáticos. Pantoprazol se metaboliza por CYP2C19 y en menor medida por CYP3A4, por lo que sus niveles plasmáticos podrían modificarse por inhibidores potentes (fluconazol, fluvoxamina, ticlopidina) o inductores (rifampicina) de ambos isoenzimas. También existen ciertos riesgos con fármacos que afecten a un solo isoenzima, especialmente al CYP2C19, que es el mayoritario. No se considera necesario un reajuste posológico, ya que el efecto sería como el observado en metabolizadores lentos, pero podría ser más importante en caso de insuficiencia hepática grave y tratamiento a largo plazo.

- Inhibidores de la proteasa (IP). Los IBP podrían alterar los niveles plasmáticos de determinados IP, bien por el incremento del pH o por la inhibición del CYP2C19.

Se han descrito reducciones importantes en los niveles plasmáticos de nelfinavir y de atazanavir. No se aconseja combinar con nelfinavir o atazanavir. Si no fuera posible evitar esta asociación, se aconseja aumentar la dosis de atazanavir de 300 a 400 mg y no exceder la dosis de pantoprazol de 20 mg/24 h. No obstante, este incremento de dosis no contrarrestó totalmente el efecto sobre los niveles plasmáticos del atazanavir, por lo que se aconseja evaluar la respuesta en el paciente.

Se ha descrito un incremento en los niveles de saquinavir de hasta el doble.

Finalmente no se han observado alteraciones farmacocinéticas importantes al combinar con amprenavir, darunavir, fosamprenavir, lopinavir o tipranavir.

- Metotrexato. Los IBP podrían aumentar los niveles séricos de metotrexato.

No se han encontrado interacciones farmacológicas al asociar a antiácidos, metoprolol o teofilina.

## **EMBARAZO**

Categoría B de la FDA.

Seguridad en animales: la administración en rata y coneja a dosis superiores a las recomendadas en humanos no se relacionó con efectos teratogénos o embriotóxicos.

Seguridad en humanos: se ha evaluado la seguridad gestacional de los IBP (entre ellos lansoprazol, omeprazol y pantoprazol) en varios ensayos clínicos y metaanálisis, y no se han encontrado efectos teratogénos o embriotoxicidad, aunque tampoco pueden descartarse completamente, especialmente en el caso de reacciones adversas fetales raras o de aparición retardada. No obstante, y en función de la información obtenida en estudios con animales, el riesgo no sería muy elevado.

Se desconoce si pantoprazol podría atravesar la placenta, pero debido a su bajo peso molecular este paso es posible. Otros IBP como omeprazol tienen capacidad para atravesar esta barrera. No obstante, debido a la alta unión a proteínas plasmáticas y baja t<sub>1/2</sub>, la cantidad que podría acceder al feto no se estima que pudiera ser muy alta.

Se recomienda usar con precaución, restringiendo su empleo a situaciones en las que no existen alternativas terapéuticas más seguras, y los beneficios superan los posibles riesgos.

Efectos sobre la fertilidad: no se han realizado estudios específicos acerca de sus efectos sobre la fertilidad.

## **Comentarios**

Aún no hay comentarios para este producto.