



Omeprazol pellets

Antiulceroso – inibidor da bomba de prótons

Apresentação: Pellets a 8,5 e a 10%

CAS: 73590-58-6

Sinônimos: nda

Fórmula Molecular: $C_{17}H_{19}N_3O_3S$

Peso Molecular: 345,40

Fator de correção: É necessário uso de fator de correção de acordo com teor descrito em laudo de análise

Fator de umidade: não se aplica

Fator de equivalência: não se aplica

USO ORAL

O omeprazol inibe uma enzima localizada na parede do estômago acarretando a diminuição da produção do ácido no estômago. Este medicamento apresenta ação máxima após alguns dias de tratamento.

O omeprazol cápsula é indicado no tratamento de úlceras pépticas benignas, gástricas ou duodenais; esofagite de refluxo; síndrome de Zollinger-Ellison (hiperacidez gástrica).

Para o tratamento da doença do refluxo gastroesofágico (com ou sem esofagite erosiva), o omeprazol já provou ser efetivo para alívio dos sintomas e cicatrização das lesões, sendo recomendado nos principais consensos e diretrizes atuais (DEVAULT KR, 2005).

Propriedades

O Omeprazol pellets está indicado para o tratamento de:

- Úlcera péptica gástrica, ou duodenal;
- Esofagite de refluxo;
- Síndrome de Zollinger-Ellison;
- Profilaxia de aspiração de conteúdo gástrico durante a anestesia geral em pacientes de risco.

Mecanismo de ação

O omeprazol reduz a secreção ácida gástrica por meio de mecanismo de ação altamente seletivo. Este medicamento produz inibição específica da enzima $H^+ / K^+ -ATPase$ ("bomba de prótons") nas células parietais. Esta ação farmacológica, dose-dependente, inibe a etapa final da formação de ácido no estômago, proporcionando, assim, uma inibição altamente efetiva, tanto da secreção ácida basal, quanto na estimulada, independentemente do estímulo. O omeprazol atua de forma específica, exclusivamente nas células parietais, não possuindo ação sobre receptores de acetilcolina e histamina. O início da ação deste medicamento é rápido e o controle reversível da secreção ácida é obtido com uma única administração diária. Dose diária única do medicamento oferece uma rápida e efetiva inibição da secreção ácida gástrica com efeito máximo atingido dentro dos primeiros quatro dias de tratamento. Não foi observado até o momento, fenômeno de taquifilaxia durante o tratamento com omeprazol. A taxa de ligação proteica é de aproximadamente 95%.

O omeprazol é completamente metabolizado, principalmente no fígado, no sistema citocromo P450, mais especificamente na isoenzima CYP2C19 (e em menor grau CYP3A4), sendo seus metabólitos desprovidos de ação significativa na secreção ácida. Aproximadamente 80% da dose administrada são excretada como metabólitos na urina e o restante é encontrado nas fezes.

Comprovação eficácia

Com relação à redução na secreção ácida, o omeprazol sódico demonstrou ser efetivo com redução da secreção ácida basal de 33,9 mmol/h para 9,5 mmol/h após dose única de 40mg (ROHSS K, 2007) .

Para o tratamento da doença do refluxo gastroesofágico (com ou sem esofagite erosiva), o omeprazol já provou ser efetivo para alívio dos sintomas e cicatrização das lesões, sendo recomendado nos principais consensos e diretrizes atuais (DEVAULT KR, 2005).

Na doença ulcerosa péptica, sua eficácia também já foi amplamente estudada. Quando associada à infecção por *Helicobacter pylori* os estudos atestam a eficácia do omeprazol como componente dos esquemas de erradicação da bactéria (CHEY WD, 2007).

Na doença ulcerosa péptica não relacionada ao *H. pylori*, como na síndrome de Zollinger-Ellison, sua eficácia também já foi comprovada embora haja necessidade de doses mais elevadas do que quando a lesão é associada à infecção (QUAN C, 2002).



Indicações e aplicações

O Omeprazol pellets está indicado para o tratamento de:

- Úlcera péptica gástrica, ou duodenal;
- Esofagite de refluxo;
- Síndrome de Zollinger-Ellison;
- Profilaxia de aspiração de conteúdo gástrico durante a anestesia geral em pacientes de risco.

Concentração usual

A dose para adultos no tratamento de úlcera duodenal ativa, distúrbios gastroesofágicos de refluxo ou na esofagite severa é de 20mg/dia durante 4 a 8 semanas. Nas condições patológicas hipersecretórias, inicialmente 60mg/dia. Doses até 120mg/3 vezes ao dia têm sido administradas. Nas úlceras gástricas, administrar 40mg/dia durante 4 a 8 semanas. No tratamento da H pylori, a dose oral para adultos é de 20mg/2 vezes ao dia, combinando à terapia com Claritromicina, antagonistas H2 ou outros. Usualmente utiliza-se de 10 a 40mg. Geralmente 20mg via oral em jejum pela manhã.

Não é necessário o ajuste de doses para pacientes idosos.

Crianças: Devido à escassez de dados na literatura sobre a segurança do uso do omeprazol sódico em crianças, seu uso não está recomendado nesta faixa etária.

Informações de Segurança

Advertências: Quando há suspeita de úlcera gástrica, a possibilidade de malignidade da lesão deve ser precocemente afastada, uma vez que o tratamento com omeprazol sódico pode aliviar os sintomas e retardar o diagnóstico desta patologia.

Gravidez e lactação: Omeprazol sódico não deve ser administrado quando houver gravidez suspeita ou confirmada ou durante a lactação, a não ser que, a critério médico, os benefícios do tratamento superem os riscos potenciais para o feto. Estudos realizados evidenciaram que a administração de omeprazol sódico a mulheres grávidas em trabalho de parto, em doses de até 80mg durante 24 (vinte e quatro) horas não acarretou qualquer efeito adverso para a criança. Além disso, estudos em animais de laboratório não demonstraram evidências de risco com a administração de omeprazol durante a gravidez e lactação e não se observaram toxicidade fetal, ou efeitos teratogênicos. Os estudos em animais não demonstraram risco fetal, mas também não há estudos controlados em mulheres grávidas.

Reações adversas

Omeprazol pellets é bem tolerado, e as reações adversas são geralmente leves e reversíveis. Algumas reações foram relatadas; entretanto, em muitos casos, não foi possível estabelecer relação consistente com o tratamento.

Frequentes (1-10%)

Sistema nervoso central e periférico: cefaleia. Gastrointestinal: diarreia; obstipação; dor abdominal; náuseas/vômitos; flatulência. Blau Farmacêutica S/A.

Pouco frequentes (0,1-1%)

Sistema nervoso central e periférico: tontura; parestesias cutâneas; sonolência; insônia; vertigem. Hepático: aumento dos níveis de transaminases. Pele: dermatite devido a substâncias de uso interno; prurido; urticária. Outros: mal-estar.

Raras (0,01-0,1%)

Sistema nervoso central e periférico: desorientação não especificada; agitação; hostilidade; depressão; alucinações, principalmente em pacientes em estado grave. Endócrino: ginecomastia. Gastrointestinal: boca seca; estomatite sem outra especificação; estomatite por Cândida; candidíase gastrointestinal (candidíase não especificada). Hematológico: leucopenia; trombocitopenia; agranulocitose; pancitopenia. Hepático: encefalopatia hepática em pacientes com insuficiência hepática grave pré-existente; hepatite com ou sem icterícia; insuficiência hepática. Musculoesquelético: dor articular; fraqueza muscular; mialgia. Pele: resposta fototóxica, eritema polimorfo; síndrome de Stevens-Johnson; necrólise epidérmica tóxica; alopecia sem outra especificação. Outros: reações de hipersensibilidade como, por exemplo, angioedema; febre; broncoespasmo; nefrite túbulo-intersticial; choque anafilático. Sudorese; edema periférico; visão turva; parageusia (alteração do paladar); hiponatremia, hipomagnesemia, hipocalcemia, hipocalemia, deficiência de cianocobalamina.

Contraindicações

O omeprazol pellets não deve ser utilizado por pacientes que apresentam hipersensibilidade ao omeprazol ou a qualquer componente da fórmula. O omeprazol pellets deve ser utilizado somente sob orientação médica. Você não



deve utilizar este medicamento durante a gravidez e a amamentação, exceto sob orientação médica nos casos em que os benefícios do tratamento para a paciente superam os riscos potenciais para o feto ou para o lactente. Informe ao seu médico ou cirurgião dentista se ocorrer gravidez durante ou após o término do tratamento ou se for amamentar durante o uso deste medicamento

Interações medicamentosas

A utilização de omeprazol sódico em pacientes em terapia com clopidogrel leva a redução da eficácia deste fármaco uma vez que se trata de uma pró- medicação que é metabolizada pelo CYP2C19, resultando em seu metabólito ativo. A competição pela isoenzima com o omeprazol leva a prejuízo na terapêutica deste agregante plaquetário. Desta forma, o uso concomitante de omeprazol e clopidogrel deve ser evitado. A absorção de alguns fármacos pode ser alterada devido à diminuição da acidez intragástrica. Portanto, pode-se prever que, durante o tratamento com omeprazol sódico, a absorção de cetoconazol diminuirá, assim como durante o tratamento com outros inibidores da secreção ácida, ou com antiácidos. Não foi encontrada interação com a administração concomitante de antiácidos ou alimentos. Como omeprazol sódico é metabolizado pelo fígado, mediante citocromo P450, pode prolongar a eliminação de diazepam, varfarina e fenitoína. Pacientes sob tratamento com varfarina ou fenitoína devem ser monitorados, podendo ser necessária uma redução da dose destes fármacos. Entretanto, em pacientes sob tratamento contínuo com fenitoína, o tratamento concomitante com omeprazol sódico, na dose de 20mg/dia, não alterou a concentração sanguínea da fenitoína. Da mesma forma, pacientes em tratamento contínuo com varfarina concomitantemente com 20mg/dia de omeprazol, não apresentaram alterações no tempo de coagulação. Durante tratamento concomitante de omeprazol sódico com claritromicina, ocorre aumento nas concentrações plasmáticas de ambas as substâncias. Estudos de interação medicamentosa de omeprazol sódico com outras medicações indicam que 20-40mg de omeprazol sódico administrado repetidamente não têm influência sobre outros fármacos como cafeína, fenacetina, teofilina, piroxicam, diclofenaco, naproxeno, metoprolol, propranolol, etanol, ciclosporina, lidocaína, quinidina e estradiol.

Recomendações farmacotécnicas

Composição dos pellets: manitol, sucrose, fosfato hidrogenado dissódico, lauril sulfato de sódio, Hidroxipropilmetilcelulose (HPMC), carbonato de cálcio, amido, copolímero de ácido metacrílico, dietil ftalato, dióxido de titânio, talco, água purificada.

Excipiente sugerido: pellets inertes.

Informações de armazenamento

Verificar a informação no rótulo do produto.

Referências bibliográficas

Chey WD, Wong BC. American College of Gastroenterology guideline on the management of Helicobacter pylori infection. Am J Gastroenterol 2007; 102:1808-25.

DeVault KR, Castell DO. Updated guidelines for the diagnosis and treatment of gastroesophageal reflux disease. Am J Gastroenterol 2005; 100:190-200.

Quan C, Talley NJ. Management of peptic ulcer disease not related to Helicobacter pylori or NSAIDs. Am J Gastroenterol 2002; 97:2950-61.

Rohss K, Wilder-Smith C, Kilham J, Fjellman M, Lind T. Suppression of gastric acid with intravenous esomeprazole and omeprazole: results of 3 studies in healthy subjects. Int J Clin Pharmacol Ther 2007; 45:345-54.