



Eficacia ante todo.

GASTROZOLE[®] Eq

Pasta oral

COMPOSICIÓN:

Cada Jeringa de **GASTROZOLE[®] Eq**, contiene:

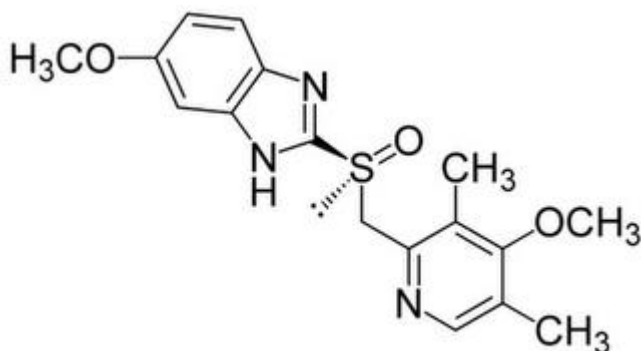
Omeprazole	2.4 g
Excipientes c.s.p	6.42 g

DESCRIPCIÓN:

GASTROZOLE[®] Eq es Omeprazol en pasta como inhibidor de la bomba de protones o de los ácidos gástricos, que en medio ácido es activado a Sulfenamida que se une de forma irreversible a los iones H^+ y K^+ de las células parietales gástricas y a la enzima ATP asa que bombean los iones hidrogeno dentro del lumen del estómago en intercambio por los iones de potasio, bloqueando la secreción de HCl.

Inhibe la secreción ácida tanto en condiciones basales o estimuladas.

INFORMACIÓN QUÍMICA:



Fórmula estructural del omeprazol.



Eficacia ante todo.

El Omeprazol es un derivado bencilmidazolico sustituido, con alta potencia y selectividad en su acción inhibitoria de la secreción ácida gástrica tanto basal como estimulada en animales y en el hombre; cuyo mecanismo único de actuación para reducir la secreción ácida es la inhibición de la enzima hidrógeno/potasio adenosina trifosfatasa o (H⁺/K⁺)ATPasa gástrica (enzima inhibitoria de la bomba de protones de las células parietales u oxínticas, gástricas); su selectividad de acción se basa en que sólo actúa sobre la enzima de origen gástrico. La actuación de la bomba de protones se produce en la fase final común de los procesos secretores gástricos, de lo que se infiere que el omeprazol puede reducir la acidez intragástrica, independientemente de la naturaleza del estímulo primario.

Estos fármacos son potentes antagonistas de la bomba de protones de H⁺-K⁺-ATPasa, paso final en la estimulación de la secreción del ácido gástrico por cualquier secretagogo.

El omeprazol es aproximadamente 30 veces más potente como antiácido que la cimetidina (Lampkin et al., 1990). La disolución se produce en el medio alcalino del intestino delgado; puesto que su biodisponibilidad oral aumenta con el pH del medio intestinal, las concentraciones del omeprazol en el plasma tienden a incrementarse en los primeros 4 a 5 días de medicación.

El omeprazol se reparte selectivamente de la circulación general al medio ácido de las células parietales (pK_a 1) comparadas con otras células (pK_a 5). En el medio ácido el omeprazol se protona y se transforma subsecuentemente en el inhibidor activo.

El Adenosin Trifosfato- potasio (H⁺-K⁺-ATPasa), fuente de energía de la bomba de protones es inhibido potente e irreversiblemente; como consecuencia el omeprazol no solamente no se acumula, sino que se inactiva cuando alcanza su efecto antiácido.

El Omeprazol se ha estudiado en perros y caballos; en caballos el tiempo medio de eliminación es de 30 minutos. La biodisponibilidad oral es reducida aunque se pueden alcanzar concentraciones terapéuticas.

Las reacciones adversas originadas por el omeprazol son reducidas porque el fármaco es selectivo para la bomba (H⁺-K⁺-ATPasa).

Se han señalado diarreas y fluctuaciones transitorias de las enzimas hepáticas, se han registrado en enfermos humanos hipergastrinemia como consecuencia de la terapia con omeprazol, pero no se ha estudiado el efecto de rebote de hipersecreción de ácido gástrico.



Eficacia ante todo.

MECANISMO DE ACCIÓN

El omeprazol es una base débil lipofílica con un pK de 4,0. A un pH de aproximadamente 7, el omeprazol no presenta carga eléctrica y es altamente liposoluble, por lo que puede atravesar las membranas celulares con facilidad. Cuando alcanza la célula parietal, atraviesa la membrana celular por difusión pasiva; en los canalículos secretores de estas células en fase activa, el fármaco está expuesto a pH menor de 2,0 (próximo a 1), a partir del cual el omeprazol se ioniza por un proceso de protonación, originando una molécula activa estable a pH ácido llamada sulfenamida que no es lipofílica y cuya carga positiva le impide atravesar la membrana de la célula parietal, siendo acumulado y concentrado en el canalículo.

El omeprazol como tal, es inactivo pero en medio ácido, al pasar a la forma activa sulfenamida, reacciona formando una unión covalente mediante los grupos sulfhidrido (tiol) de los radicales de la cisteína de la superficie extracelular de su subunidad alfa y la H⁺/K⁺-ATPasa, inhibiendo la actividad de esta última de forma irreversible.

El posterior inicio de la actividad secretora, inhibida por el omeprazol, requiere nueva aparición, mediante síntesis de la enzima inhibida cuya vida media aproximada es de 18 horas.

FARMACOCINÉTICA:

La exposición del omeprazol al pH gástrico lo degrada en su mayor parte y le confiere una biodisponibilidad escasa, por lo que se formula en gránulos sensibles al pH, capaces de liberar la sustancia exclusivamente cuando los valores de éste sean superiores a 6. Formulado así, la biodisponibilidad del omeprazol aumenta hasta el 50 %. En estas condiciones se absorbe en el intestino y alcanza las células parietales del estómago a través del torrente circulatorio. Las características de absorción son altamente dependientes de las distintas formulaciones, por lo que su biodisponibilidad por vía oral también variará entre los distintos preparados.

La biodisponibilidad del omeprazol y la supresión de la acidez gástrica son iguales cuando se administra el omeprazol oral o por sonda nasogástrica. La velocidad, pero no la extensión de la absorción del omeprazol se altera por administración concomitante de alimentos, por ello debe administrarse cuando el estómago esté



Eficacia ante todo.

vacío, preferiblemente por ello al levantarse, sin que influya el tiempo transcurrido entre la administración del medicamento y la ingestión posterior de comida.

El tiempo medio para alcanzar las concentraciones plasmáticas máximas (Tmax) es altamente dependiente de la formulación; es menor de 20 minutos en soluciones orales, de 30 minutos para gránulos de omeprazol no recubiertos y se sitúa entre dos y cinco horas en gránulos con recubrimiento entérico.

En general se acepta que el pico máximo plasmático se alcanza con mayor frecuencia en los distintos medicamentos sólidos de administración oral a las dos horas de ser administrado y que éste se incrementa durante los primeros días de tratamiento con el fármaco, probablemente porque un incremento de la inhibición secretora ácida gástrica conduce a una menor degradación del omeprazol en el lumen gástrico.

La vida media plasmática del omeprazol es de 60 minutos pero como forma un enlace covalente con la enzima estimuladora de la bomba de protones, el efecto terapéutico de una dosis simple del fármaco se mantiene más de 24 horas. Por ello, el grado de inhibición secretora del omeprazol, no se correlaciona con su concentración plasmática sino con el área bajo la curva de concentración plasmática respecto al tiempo.

Como la sustancia es rápidamente eliminada y su vida media plasmática no cambia significativamente con administraciones repetidas parece que el aumento de la absorción del omeprazol sea autolimitante con lo que no se obtiene excesiva acumulación del fármaco. Esto se correlaciona con los datos farmacodinámicos que indican que la administración diaria repetida de omeprazol origina un aumento del efecto antsecretorio que alcanza la meseta terapéutica entre los tres y los cinco días posteriores al inicio del tratamiento.

El omeprazol se elimina rápida y casi completamente por metabolismo. El 60% de los metabolitos se excretan por la orina en las primeras seis horas; en los cuatro días siguientes se elimina hasta un 75-78% de los restantes; aproximadamente un 18-19% de la dosis administrada se excreta en heces después de ser extraídos del plasma sus metabolitos por secreción biliar y expulsados desde la membrana gastrointestinal.

En su metabolismo interviene ampliamente el sistema del citocromo P-450 hepático por lo que sobre él pueden interaccionar los procesos metabólicos de otros fármacos que utilizan el mismo sistema de transformación.



Eficacia ante todo.

Los metabolitos más importantes del omeprazol en el plasma son: omeprazol sulfona, omeprazol sulfito e hidroxioimeprazol.

Su farmacocinética no se altera en pacientes con insuficiencia de la función renal pero en adultos y en insuficiencia hepática, el metabolismo del omeprazol se hace más lento y su biodisponibilidad aumenta con respecto a los valores que presentan los adultos; en general no se requiere ningún ajuste de dosificación en estos casos. (Molero Gómez, R., 1997).

INDICACIONES:

Para el tratamiento y prevención del síndrome de úlcera gástrica en caballos, yeguas y potros mayores a 4 semanas de edad. Tratamiento de esofagitis, gastritis erosiva, úlceras gastroduodenales y gastritis causadas por drogas ulcerogénicas, como el flunixin meglumine o la fenilbutazona.

Para prevenir alteraciones digestivas como la gastritis causada por el estrés generado en las competencias, ferias, transporte, hiperpráctica deportiva, manejo, etc.

DOSIS Y VÍA DE ADMINISTRACIÓN:

Pasta para administración vía oral.

Tratamiento de úlceras gástricas: Administrar **GASTROZOLE[®] Eq** a la dosis de 4 mg/kg de peso, una vez al día durante 28 días consecutivos. En la práctica cada marca en el émbolo dosificador sirve para tratar 100 kg de peso vivo.

Prevención y reincidencia de las úlceras: Continuar con el tratamiento de **GASTROZOLE[®] Eq** por 28 días adicionales, a la dosis de 2 mg/kg de peso, una vez al día. En la práctica cada marca en el émbolo dosificador sirve para tratar 200 kg de peso vivo.

Como prevención de gastritis causada por el estrés generado en las competencias, ferias, transporte, hiperpráctica deportiva, manejo, etc. a la dosis de 2 mg/kg de peso, una vez al día. En la práctica cada marca en el émbolo dosificador sirve para tratar 200 kg de peso vivo.



Eficacia ante todo.

La estrategia es suministrar diario a partir de dos días antes del desplazamiento a las ferias o competencias y dos días después la dosis de un cuarto de jeringa para 300 kilos de peso.

Se recomienda la administración en ayuno. Gradué el anillo de la jeringa a la dosis a suministrar. Abra el anillo, deslícelo a lo largo de la barra del émbolo, gire el anillo $\frac{1}{4}$ y asegúrese que quede cerrado (sin movimiento).

Asegúrese que la boca del animal no contiene alimento. Retire la tapa de la jeringa e inserte la jeringa en el hocico del caballo en el la parte de atrás de la lengua. Oprima el émbolo hasta que se detenga por el anillo. Asegúrese de que el animal tratado trago el producto, en caso de rechazo o pérdida de dosis, se recomienda volver dosificar.

TIEMPO DE RETIRO:

No usar el producto en caballos destinados para consumo humano.

PRESENTACIONES:

Caja por 7 jeringas, cada una por 6,4 g, con 2.4 gramos de omeprazol

Licencia Registro. I.C.A.

N° 8847 – MV