

TEGOPRAZÁN: Opción eficaz para abordar
las limitaciones de los IBP

Ki-CAB[®]

Tegoprazan 50mg

CARNOT[®]
LABORATORIOS



* Material sólo para fines informativos y de uso exclusivo para cuerpo médico

Ki-CAB[®]

Tegoprazan 50mg

TEGOPRAZÁN: **Opción eficaz para abordar las limitaciones de los IBP**



La eficacia relativa de los nuevos tratamientos para superar las limitaciones de los medicamentos inhibidores del ácido gástrico con frecuencia se compara según su potencia; sin embargo, este término no está definido y no permite tomar decisiones clínicas racionales con base en la evidencia. Por lo tanto, específicamente en la cicatrización de úlceras duodenales y gástricas, así como en la esofagitis erosiva (EE), se considera que los criterios de eficacia son el grado de supresión de ácido gástrico, la duración de la supresión durante 24 horas y la duración del tratamiento.¹

En el tratamiento de los trastornos relacionados con la secreción de ácido se han identificado varias limitaciones, sobre todo en el manejo de la enfermedad por reflujo gastroesofágico (ERGE), la erradicación de la infección por ***H. pylori***, la protección contra las lesiones causadas por la aspirina y los antiinflamatorios no esteroideos (AINE) y el manejo de las hemorragias digestivas altas. Si bien se han desarrollado IBP de nueva generación, preparaciones de liberación dosificada y nuevas moléculas, como tenatoprazol, que han logrado un mejor control del pH intragástrico, se considera que el mayor avance en términos de manejo farmacológico es la introducción de los bloqueadores de ácido competitivos de potasio (P-CAB), los cuales actúan en el transportador H⁺/K⁺ ATPasa de la membrana luminal de las células parietales gástricas independientemente de la ingesta de alimentos, tienen un rápido inicio de acción y mantienen un aumento prolongado y constante del pH intragástrico, además de ofrecer la oportunidad de elegir un tratamiento más individualizado.¹

En comparación con los IBP, los P-CAB ofrecen una mejor flexibilidad de dosificación, un rápido inicio de acción y un efecto sostenido para lograr el control incluso durante la noche.¹

En comparación con los IBP, los P-CAB tienen una gran utilidad potencial en la práctica clínica en todo el espectro de trastornos ácido-pépticos. En particular, las características que distinguen a los P-CAB de los IBP deberían facilitar su introducción en las opciones principales para el tratamiento de pacientes que padecen enfermedad por reflujo gastroesofágico (ERGE), incluida la EE, e infecciones por ***H. pylori***.^{1,2}

Diferencia entre los mecanismos de acción de los IBP y los P-CAB

Los IBP de liberación prolongada son profármacos y requieren la activación del ácido para su funcionamiento, además de que les toma 3 a 5 días alcanzar un efecto antisecretor estable, por lo que el alivio de los síntomas es lento. Entre los factores que disminuyen la eficacia de estos medicamentos se incluye el corto tiempo de permanencia en el plasma, entre 1 a 1,5 horas, por lo que poco o nada del medicamento sigue en circulación para unirse a las bombas de protones de 5 a 7 horas después de su administración. Otra desventaja de los IBP es la necesidad de administrarlos entre 30 a 60 minutos antes de la ingesta de alimentos para garantizar niveles adecuados del medicamento antes de la activación de la bomba de protones, por lo que la eficacia inhibidora del ácido gástrico depende parcialmente del momento en que se ingieren los alimentos.¹

Teniendo en cuenta las limitaciones anteriores, se considera que el desarrollo de nuevas estrategias farmacológicas para el tratamiento de los trastornos relacionados con la secreción de ácido deben enfocarse principalmente en tres puntos, a saber, en la flexibilidad del

Los perfiles farmacodinámico y farmacocinético de los P-CAB presentan otras propiedades potencialmente beneficiosas. En particular, la vida media más prolongada de los P-CAB permite una inhibición de las nuevas bombas sintetizadas y, por tanto, una mayor duración de acción que los IBP.²

momento de dosificación, el rápido inicio de la inhibición del ácido y la previsibilidad del efecto antisecretor de ácido en un periodo de 24 horas en función de la dosis, sobre todo para combatir el trastorno durante la noche.¹

Dado que no son profármacos, los P-CAB se pueden administrar independientemente de la ingesta de alimentos, ofrecen un rápido inicio de acción y sus niveles plasmáticos exhiben mayor estabilidad, por lo que su grado y duración del efecto antisecretor de ácido es más controlable.¹ Respecto a su mecanismo de acción, los P-CAB actúan en el transportador H⁺/K⁺ ATPasa de la membrana luminal de las células parietales gástricas, las cuales son las mismas bombas de protones a las que se dirige la acción de los IBP. Tras su absorción sistémica, los P-CAB se concentran en los canalículos de las células parietales y se unen de forma reversible a los transportadores de H⁺/K⁺ ATPasa para impedir la secreción de protones acidificantes. Una vez unidos, los P-CAB bloquean el acceso de iones K⁺ a la bomba de protones. A diferencia de los IBP, los P-CAB son estables en presencia del ácido, por lo que no requieren un recubrimiento entérico ni una administración 30 minutos antes de la ingesta de alimentos (**tabla 1**).²

Tabla 1. Comparación entre los P-CABS y los IBP

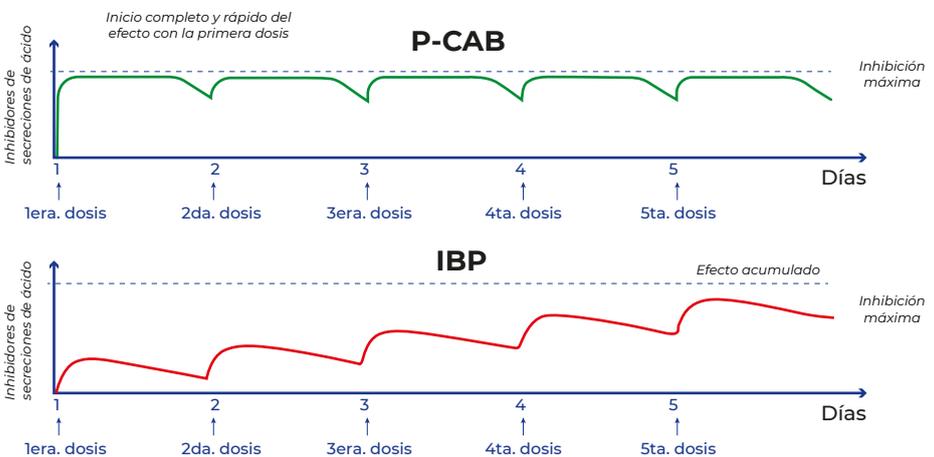
| | P-CAB | IBP |
|-----------------------------------|--------------------|-------------------------|
| Profármaco | No | Sí |
| Estabilidad en presencia de ácido | Sí | No |
| Inhibición y unión | Reversible, iónica | Irreversible, covalente |

| | P-CAB | IBP |
|---|--|--|
| Inhibición máxima del ácido después de la dosis | 1 día (vonoprazán) | 3-5 días |
| Vida media | 6-9 horas | 1-2 horas |
| Alteración significativa por la variabilidad de CYP2C19 | No | Sí |
| Administración óptima de la dosis | Independiente de ingesta de alimentos (antes o después de las comidas) | 30 - 60 minutos antes de las comidas (la mayoría de los IBP) |

Adaptado de: Wong N, et al. Gastroenterol Hepatol (N Y). 2022 Dec;18 (12): 693-700.

Los P-CAB ofrecen una elevación más rápida del pH intragástrico que un IBP de liberación prolongada, y mantiene simultáneamente el mismo grado de efecto antisecretor, cuya duración depende de la vida media y se puede modificar mediante fórmulas de liberación prolongada (**figura 1**).¹

Figura 1. Evolución temporal de la inhibición de ácido ejercida por los P-CAB y los IBP; simulación por computador.



Adaptado de: Hunt RH, et al. Curr Treat Options Gastroenterol. 2018 Dec;16(4):570-590.

P-CAB en enfermedad por reflujo gastroesofágico (ERGE) e infección por *H. pylori*.

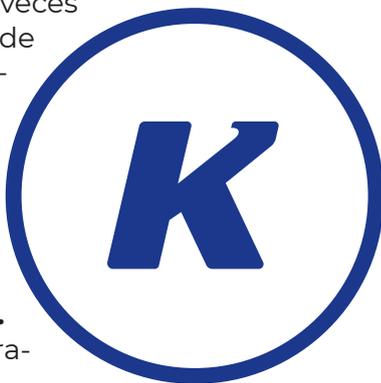
La ERGE sigue siendo una de las enfermedades más frecuentes en las consultas de los gastroenterólogos, quienes por lo general consideran que las formulaciones que incluyen un IBP son el tratamiento de referencia para la supresión de la acidez gástrica y el alivio de los síntomas. En la EE, los P-CAB han demostrado su eficacia y utilidad para la supresión de la acidez gástrica. Específicamente, se ha demostrado que tegoprazán inhibe el ácido de forma eficaz y duradera en voluntarios sanos, según la monitorización del pH intragástrico, lo cual sugiere que los P-CAB deberían ser eficaces para los síntomas derivados directamente de la exposición al ácido esofágico.²

En el contexto de la infección por *H. pylori*, ha aumentado la demanda de tratamientos eficaces y sobre todo de esquemas que puedan combatir la resistencia a los antibióticos. En el informe del consenso de Maastricht VI/Florencia 2021 se estableció que, en comparación con la terapia tripe convencional con IBP, los esquemas que incluyen P-CAB demostraron superioridad, e incluso ausencia de inferioridad, como tratamientos de primera y segunda línea para la erradicación de *H. pylori*, y fueron superiores en el manejo de infecciones resistentes a los antibióticos.²

La duración del tiempo en que se mide la acidez intragástrica $\text{pH} \geq 3$ se correlaciona con la cicatrización de las úlceras duodenales y gástricas y $\text{pH} \geq 4$ se correlaciona con la cura-

ción de la esofagitis erosiva.¹ El primer estudio hecho en humanos con el P-CAB tegoprazán mostró que una sola administración por vía oral proporciona una rápida elevación del pH intragástrico ($\text{pH} > 6$) en condiciones de ayuno en voluntarios sanos. Asimismo, un estudio de búsqueda de dosis mostró que tegoprazán exhibe un perfil farmacocinético lineal después de una o múltiples dosis, así como una rápida supresión de ácido gástrico dependiente de la dosis. Como se demostró en el estudio MACH-2, la importancia del control del pH se entiende sobre todo en el tratamiento de la infección por ***H. pylori***. Dicho estudio mostró que las tasas de cicatrización con omeprazol y dos antibióticos son significativamente superiores a los mismos dos antibióticos, administrados sin omeprazol. Un resultado similar se observó con claritromicina y tinidazol administrados con o sin lansoprazol.¹

Los medicamentos inhibidores del ácido que ofrecen un control superior de la acidez diurna y nocturna podrían mejorar el cumplimiento del tratamiento. Los IBP actuales deben tomarse a altas dosis dos veces al día, mientras que un IBP de acción prolongada podría administrarse una vez al día, lo que simplificaría el tratamiento sin reducir su eficacia. En contraste, con un inhibidor de la acidez de acción prolongada podrían conseguirse altas tasas de erradicación de la infección por ***H. pylori*** en comparación con la terapia dual.¹



Conclusión

Los P-CAB tienen una gran utilidad potencial en la práctica clínica en todo el espectro de trastornos ácido-pépticos. En particular, las diferencias con respecto a los IBP en términos farmacocinéticos y farmacodinámicos deberían facilitar la introducción de los P-CAB en las opciones principales para el tratamiento de pacientes que padecen trastornos relacionados con la secreción de ácido, incluidos la ERGE, la EE grave y la infección por ***H. pylori***. Además, tras más investigación, los P-CAB podrían demostrar su eficacia para el tratamiento de otras indicaciones, tales como las hemorragias gastrointestinales no varicosas, la esofagitis eosinofílica, el síndrome de Barrett y la dispepsia.^{1,2}

Los P-CAB ofrecen una elevación más rápida del pH intragástrico que un IBP de liberación prolongada, mientras que mantienen el mismo grado de efecto antisecretor, cuya duración depende de la vida media y se puede modificar mediante fórmulas de liberación prolongada.¹ La prolongación de la supresión de ácido es fundamental sobre todo para la erradicación de la infección por ***H. pylori***, una indicación en la que los P-CAB han demostrado superioridad o ausencia de inferioridad, en comparación con las terapias convencionales con IBP.¹

Escanee este código QR para ver: acciones, indicaciones, usos terapéuticos, contraindicaciones, efectos colaterales, riesgos de administración, los riesgos de farmacodependencia y las otras precauciones y advertencias, con arreglo a lo autorizado en el registro sanitario del producto.



Ki-CAB[®]

Tegoprazan 50mg

Referencias:

1. Hunt RH, Scarpignato C. Potent Acid Suppression with PPIs and P-CABs: What's New? *Curr Treat Options Gastroenterol*. 2018 Dec;16(4):570-590.
2. Wong N, Reddy A, Patel A. Potassium-Competitive Acid Blockers: Present and Potential Utility in the Armamentarium for Acid Peptic Disorders. *Gastroenterol Hepatol (N Y)*. 2022 Dec;18(12):693-700.



KI-CAB® - REGISTRO SANITARIO No.:
INVIMA 2024M-0021568



www.ki-cab.com.co

Ofic.: +57 (601) 600 4004 / Calle 101 B # 45A-49, Bogotá - Colombia
www.carnotcolombia.com

* Material sólo para fines informativos y de uso exclusivo para cuerpo médico