

Controloc 20 mg, Controloc 40 mg

pantoprazolum

Složení

1 enterosolventní tableta obsahuje 20, respektive 40 mg pantoprazolu

Charakteristika

Pantoprazol je významným zástupcem inhibitorů protonové pumpy (PPI), jejichž zavedení do běžné klinické praxe znamenalo zásadní pokrok ve farmakoterapii onemocnění zažívacího systému. Hlavním místem účinku všech PPI je tzv. H^+/K^+ ATP-áza, běžně označovaná jako protonová pumpa. Všechny komerčně dostupné PPI jsou podávány ve formě prolečiv, pro jejichž aktivaci je nutná pasáž přes parietální buňku žaludeční sliznice. Protonizovaný cyklický sulfonamid následně ireverzibilně blokuje protonovou pumpu, a tím i influx iontů draslíku spřažený s efluxem protonizovaného vodíku. Výsledkem je snížení bazální i stimulované syntézy HCl.

Farmakokinetické vlastnosti

V dávkovém rozmezí 10–80 mg je plazmatická kinetika pantoprazolu lineární po perorálním i intravenózním podání. Maximálních plazmatických koncentrací je dosaženo přibližně za 2–3 hodiny po podání jednorázové dávky 40 mg a odpovídá koncentraci 2–3 mg/ml, přičemž po opakovaném podání se tato koncentrace výrazněji nemění. Vazba na bílkoviny plazmy dosahuje hodnoty až 98 %. Rovněž biologická dostupnost je u pantoprazolu velmi vysoká – dosahuje až 77 %, a to bez ovlivnění současným příjmem potravy. Distribuční objem odpovídá 0,15 l/kg a clearance se pohybuje kolem 0,1 l/hod/kg. Metabolizace probíhá především v játrech prostřednictvím cytochromu P450 2C19, minoritně se uplatňuje též isofорма 3A4 (zejména u aktivního metabolitu desmethylpantoprazolu) s následnou sulfatací; hlavní eliminační cestou jsou ledviny; biologický poločas odpovídá přibližně 1 hodině.

Klinické zkušenosti

V posledních letech byla publikována celá řada klinických studií s pantoprazolem, uvádí se ty nejvýznamnější.

U pacientů s refluxní chorobou jícnu (GERD) byl prostřednictvím transmisní elektronové mikroskopie hodnotící ultrastrukturální změny sliznice po 3 měsících podávání pantoprazolu zjištěn výrazně nižší počet histologických změn s následnou augmentovanou intenzitou buněčné proliferace, což nasvědčuje podpoře hojení.¹ Velice zajímavým a současně povzbudivým zjištěním bylo pozorování, že vysoce dávkovaný pantoprazol nejenom potlačuje

symptomatiku jícnové choroby jícnu, ale též výraznou měrou přispívá k normalizaci duodenogastrického refluxu (DGER), který je považován za nezávislý rizikový faktor GERD.²

S cílem porovnání účinků pantoprazolu oproti nizatidinu a famotidinu u osob s gastroesofageálním refluxem byla recentně provedena post-hoc analýza dvou již dříve publikovaných multicentrických randomizovaných a dvojitě zaslepených klinických studií. V souboru nemocných čítajícím celkem 172 osob léčených pantoprazolem 20 mg 1x denně, nizatidinem 150 mg 2x denně a nebo ranitidinem 150 mg 2x denně vedlo užívání pantoprazolu ve srovnání s oběma H_2 blokátory k výraznější a časnější úlevě od pálení žáhy a k signifikantnímu omezení kyselé regurgitace.³

Pantoprazol je účinný rovněž u osob s refluxní chorobou jícnu, kteří v jejím důsledku trpí chronickou laryngitidou či faryngitidou. V souboru 33 nemocných se, za využití 24hodinové monitorace pH distálního jícnu po 8 týdnech užívání pantoprazolu v denní dávce 80 mg, zjistila normalizace jeho hodnot u dvou třetin nemocných, což byl přímý důsledek nižšího počtu zaznamenaných refluxů. Analogické změny byly pozorovány i v proximální části jícnu, čehož klinickým korelátem byl nižší počet pozorovaných faryngitid či laryngitid.⁴

Pacienti s nadváhou nebo dokonce s obezitou a GER/GERD by dle některých prací mohli více profitovat z užití vyšší dávky pantoprazolu, tj. stejné, jako byla využita ve studii předchozí.⁵

U krvácejících peptických ulcerací byla sice recentně prokázána podobná účinnost jako při podání ranitidinu, avšak pantoprazol poskytoval větší terapeutický účinek v případech žaludečních vředů či u krvácení pocházejících z artérií.⁶ Po endoskopickém ošetření krvácejících žaludečních vředů je účinnost pantoprazolu při kontinuálním, respektive intermitentním podávání víceméně srovnatelná.⁷

Indikace

Controloc 20 mg: Lehké formy refluxní ezofagitidy a souvisejících obtíží (např. pálení žáhy, kyselá regurgitace, bolest při polykání). Dlouhodobá léčba a profylaxe recidiv refluxní ezofagitidy. Profylaxe gastroduodenálních vředů, petechií a erozí spojených s užíváním NSA a dyspeptických symptomů u pacientů, kteří pokračují v léčbě NSA.

Controloc 40 mg: Středně těžká a těžká refluxní ezofagitida. Eradikace *Helicobacter pylori* v kombinaci s antimikrobiálními přípravky. Duodenální vředy. Žaludeční vředy. Zollinger-Elisonův syndrom a další patologické stavy vyznačující se nadměrnou sekrecí.

Kontraindikace

Přecitlivělost na kteroukoliv z obsažených látek. Aplikace dětem. Těhotenství a laktace: pouze po zvážení přínosu a rizik.

Bezpečnost a lékové interakce

Všechny PPI jsou považovány za látky velmi bezpečné – z nežádoucích účinků jsou zmiňovány především zažívací potíže či bolest hlavy). Pantoprazol má nízký potenciál lékových interakcí, a to kombinace PPI s antacidami, jež omezují jejich aktivaci a kýžená blokáda protonové pumpy se tak nemůže optimálně realizovat. Oproti jiným PPI neinteraguje významně s antiagregancii, jako jsou ASA či clopidogrel.⁸

Dávkování

Obvyklá dávka v monoterapii u žaludečních a duodenálních vředů a refluxní ezofagitidy je 1 tableta (40 mg) denně, v některých případech je možno zvýšit na dvojnásobek.

Balení

Controloc 20 mg: á 14 a 28 tbl.

Controloc 40 mg: á 14, 28 a 100 tbl.

Výrobce

Nycomed

Literatura u autora

Poznámka: Statut přípravku: Léčivý přípravek, je vázán na lékařský předpis. Úhrada z prostředků veřejného zdravotního pojištění: viz číselník VZP. Profil přípravku zpracován kolektivem autorů vedeným MUDr. Jiřím Slívou, Ph.D. s využitím odborné literatury a SPC dle poslední revize (více informací o přípravku viz aktuální verze SPC).

