

# NOLPAZA 20 MG

PANTOPRAZOLUM

## SLOŽENÍ

1 enterosolventní tableta obsahuje 22,55 mg seskvihydrátu pantoprazolu sodného, což odpovídá 20 mg pantoprazolu.

## CHARAKTERISTIKA

Pantoprazol patří mezi významné zástupce inhibitorů protonové pumpy (PPI), respektive H<sup>+</sup>/K<sup>+</sup> ATP-ázy. Podáván je ve formě proléčiva, pro jehož aktivaci je nutná pasáž skrze 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 jak bazální, tak i stimulované syntézy HCl.

## FARMAKOKINETICKÉ VLASTNOSTI

Kinetika pantoprazolu je při užití běžných dávek po perorálním podání lineární. Maximální plazmatické koncentrace bývá dosaženo přibližně po 2–3 hodinách a při užití jednorázové dávky 40 mg 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 isoforma 3A4 (vznik *desmethylpantoprazolu*) s následnou sulfatací; hlavní eliminační cestou jsou ledviny; biologický poločas odpovídá přibližně 1 hodině.

## KLINICKÉ ZKUŠENOSTI

Z publikovaných klinických prací jsou v následujícím textu diskutovány ty nejzásadnější. 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.<sup>1</sup> Velice zajímavým a současně povzbudivým zjištěním bylo pozorování, že vysoce dávkovaný pantoprazol nejenom potlačuje symptomatiku refluxní choroby jícnu, ale též výraznou měrou přispívá normalizaci duodenogastrického refluxu (DGER), kterýžto je považován za nezávislý rizikový faktor GERD.<sup>2</sup>

S cílem porovnání účinků pantoprazolu oproti nizatidinu a famotidinu u osob s gastroezofageálním refluxem byla v loňském roce 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<sub>2</sub> blokátory k výraznější a časnější úlevě od pálení žáhy a k signifikantnějšímu omezení kyselé regurgitace, což lze jednoduše vysvětlit blokádou stimulované sekrece HCl u H<sub>2</sub> blokátorů na rozdíl od PPI.<sup>3</sup>

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.<sup>4</sup>

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

## INDIKACE

Přípravek je určen k léčbě či k profylaxi refluxní choroby jícnu a souvisejících obtíží (např. pálení žáhy, kyselá regurgitace, bolest při polykání). Současně může být použit v profylaxi gastroduodenálních vředů vzniklých v důsledku užívání nesteroidních antiflogistik.

## KONTRAINDIKACE, NEŽÁDOUCÍ ÚČINKY

Přípravek nesmí být užit při známé přecitlivělosti na kteroukoliv z obsažených látek. Není vhodný pro děti a u těhotných či kojících žen je možné jej užit pouze po zvážení přínosu a rizik. Kontraindikováno je rovněž současné užití s azapeptidovým inhibitorem HIV1 proteázy, atazanavirem (riziko snížení antiretrovirového účinku). PPI jsou považovány za bezpečná léčiva. Z nežádoucích účinků jsou zmiňovány například zažívací potíže či bolest hlavy.

## DÁVKOVÁNÍ

Doporučená dávka v léčbě refluxní choroby jícnu je 1 tableta (20 mg) denně podávaná po dobu 1 až 2 měsíců; v některých případech je možno ji zvýšit na dvojnásobek. Stejná dávka je určena i v dlouhodobé léčbě a profylaxi recidiv refluxní ezofagitidy i v profylaxi gastroduodenálních vředů vyvolaných NSA.

## BALENÍ

1 balení volně prodejného přípravku Nolpaza obsahuje 14 enterosolventních tablet s obsahem 20 mg účinné látky.

## VÝROBCE

KRKA, d.d., Novo mesto, Slovinsko

### Literatura

1. Calabrese C, Trere D, Liguori G *et al.* Esophageal cell proliferation in gastroesophageal reflux disease: clinical-morphological data before and after pantoprazole. *World J Gastroenterol.* 2009; 15:936-941.
2. Kunsch S, Neesse A, Linhart T *et al.* Impact of pantoprazole on duodeno-gastro-esophageal reflux (DGER). *Z.Gastroenterol.* 2009; 47:277-282.
3. Haag S, Holtmann G. Onset of relief of symptoms of gastroesophageal reflux disease: post hoc analysis of two previously published studies comparing pantoprazole 20 mg once daily with nizatidine or ranitidine 150 mg twice daily. *Clin Ther.* 2010; 32:678-690.
4. Karoui S, Bibani N, Sahtout S *et al.* Effect of pantoprazole in patients with chronic laryngitis and pharyngitis related to gastroesophageal reflux disease: clinical, proximal, and distal pH monitoring results. *Dis. Esophagus.* 2009.
5. Chen WY, Chang WL, Tsai YC, Cheng HC, Lu CC, Sheu BS. Double-dosed pantoprazole accelerates the sustained symptomatic response in overweight and obese patients with reflux esophagitis in Los Angeles grades A and B. *Am J Gastroenterol.* 2010; 105:1046-1052.

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

