

Inhibitory protonové pumpy

Inhibitory protonové pumpy (blokátory H^+/K^+ ATPázy) jsou chemicky deriváty benzimidazolu. Blokádou protonové pumpy lze dosáhnout téměř úplného potlačení sekrece kyseliny chlorovodíkové v žaludku. Jedná se většinou o biologicky neaktivní substance (prekurzor), které se v organismu přeměňují na aktivní formu.^[1]

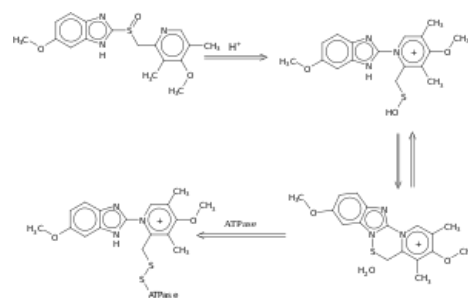
Mechanismus účinku

Po vstřebání z tenkého střeva se dostává omeprazol (prekurzor) krevní cestou do krycích (parietálních) buněk žaludeční sliznice. Tam se v kyselém prostředí přemění na spiroderivát, odštěpením vody vznikne pak účinný metabolit (sulfenamid), který ireverzibilně blokuje H^+/K^+ ATPázu. Přestože mají benzimidazolové deriváty krátký poločas rozpadu, přetrvává jejich účinek 1 až 3 dny.^[1]

Farmakokinetika

Tyto látky jsou nestabilní v kyselém prostředí, proto je u nich důležitá acidorezistentní úprava lékové formy. Biologická dostupnost omeprazolu je iniciálně asi 40 %, ale po opakovaném podání stoupá až na 65 %. U derivátů (pantoprazol, lansoprazol, rabeprazol) je biologická dostupnost konstantní. Zbytek účinné látky, která se v parietálních buňkách nevstřebá, se v játrech přeměňuje na hydroxyderiváty a sulfony. Ty se přednostně vylučují ledvinami.

Inhibitory protonové pumpy se metabolizují především prostřednictvím CYP2C19, (ev. CYP3A), tudíž je možná například interakce s warfarinem, diazepamem, fenytoinem a dalšími léčivy. Inhibitory protonové pumpy také zhoršují resorpci vitamínu B12 a ketokonazolu, dále zvyšují resorpci digoxinu.^[1]



Aktivace omeprazolu

Nežádoucí účinky

U všech účinných látek této skupiny jsou nežádoucí účinky podobné. Jedná se hlavně o poruchy trávení, únavu, závratě. Důležité je neopomenout možnost těžké poruchy sluchu a vidění u parenterálního podání těchto léčiv, proto by se měly touto cestou podat spíše ve formě krátkodobé infuze.^[1]



Indikace

- Refluxní choroba jícnu
- peptický vřed žaludku a duodena
- akutní gastritidy
- gastropatie^[2]

Kontraindikace

Není vhodné užívat při těžkých jaterních poruchách.^[2]

Dávkování

Účinná látka	Denní dávka ^[2]
Omeprazol 	20–40 mg
Esomeprazol 	20–40 mg
Lansoprazol 	15–30 mg
Pantoprazol 	20–40 mg
Rabeprazol 	20–40 mg



Omeprazol

Odkazy

Související články

- Farmakokinetika
- Iontové pumpy

Externí odkazy

- Protonová pumpa (článek na české Wikipedii)

Reference

1. MUTSCHLER, Ernst, et al. *Arzneimittelwirkungen, Lehrbuch der Pharmakologie und Toxikologie*. 9. vydání vydání. Stuttgart. 2008. 1244 s. ISBN 978-3-8047-1952-1.
2. ČEŠKA, Richard, et al. *Interna*. 1. vydání. Praha : Triton, 2010. 855 s. ISBN 978-80-7387-423-0.

Použitá literatura

- PANTOFLÍČKOVÁ, D. Jak se od sebe liší inhibitory protonové pumpy. *Bulletin HPB chirurgie* [online]. 2002, roč. 10, no. supplement, s. -, dostupné také z <<http://www.hpb.cz/index.php?pld=02-sup-02>>. ISSN 1210-6755.