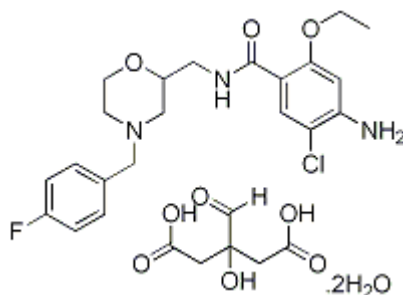


ยานำรู้

Mosapride citrate tablet 5 mg

เบญจวรรณ อ่อนคำ ภ.บ.*

สูตรโครงสร้าง



ชื่อสามัญยา

Mosapride citrate

ประเภทยา

Gastroprokinetic drug (5-HT₄ receptor agonist)

ชื่อการค้า

Gasmotin[®]

รูปแบบของยา

ยาเม็ดเคลือบฟิล์มสีขาว 1 เม็ด ประกอบด้วยยา Mosapride citrate (anhydrous form) 5 mg

ชื่อทางเคมี

(±)-4-amino-5-chloro-2-ethoxy-N-[[4-(4-fluorobenzyl)-2-morpholinyl]methyl]benzamide citrate dihydrate

กลไกการออกฤทธิ์

Mosapride citrate ออกฤทธิ์จำเพาะผ่าน serotonin 5-HT₄ receptor โดยยาจะไปกระตุ้นตัวรับ 5-HT₄ ที่มีอยู่บริเวณข่ายประสาทของทางเดินอาหาร ซึ่งทำให้มีการหลั่งสารอะซิติลโคลีน

สูตรโมเลกุล

C₂₁H₂₅ClFN₃O₃ . C₆H₈O₇ . 2H₂O

* กลุ่มงานเภสัชกรรม โรงพยาบาลพระปกเกล้า จังหวัดจันทบุรี

ออกมามากขึ้น มีผลทำให้การเคลื่อนไหวของทางเดินอาหารและการขับเคลื่อนอาหารออกจากกระเพาะเพิ่มมากขึ้น

วิธีการขั้บยา: ยาถูกขับออกมาทางปัสสาวะและอุจจาระ

ร้อยละ 0.1 ขับออกมาในรูปแบบที่ไม่มีการเปลี่ยนแปลง

เภสัชจลนศาสตร์

ร้อยละ 7.0 ขับออกมาในรูปแบบเมตาบอไลต์

เวลาที่ยาถึงระดับสูงสุด (Tmax) 0.8 + 0.1 ชั่วโมง

หลัก (des-4-fluorobenzyl)

ความเข้มข้นสูงสุด (Cmax) 30.7 + 2.7

ข้อบ่งใช้

นาโนกรัม/มิลลิลิตร

อาการของระบบทางเดินอาหารที่เกิด

ค่าครึ่งชีวิต (T1/2) 2.0 + 0.2 ชั่วโมง

เนื่องจาก functional dyspepsia (กระเพาะอาหารอักเสบเรื้อรัง แสบร้อนในอก คลื่นไส้ อาเจียน)

อัตราการจับกับโปรตีนในพลาสมา (Pro-

tein binding) ร้อยละ 99

ขนาดยา

เมตาบอไลต์หลัก: สารประกอบจำพวก des-4-fluorobenzyl

ผู้ใหญ่ ให้ mosapride citrate 15 มิลลิกรัม

เอ็นไซม์ที่เกี่ยวข้องกับเมตาบอลิซึม ส่วนใหญ่เมตาบอไลต์ผ่านเอ็นไซม์ CYP3A4

ต่อวันโดยแบ่งรับประทานวันละ 3 ครั้ง โดยให้ก่อนหรือหลังอาหาร

อาการไม่พึงประสงค์

ประเภท	ร้อยละ 0.1 ถึงน้อยกว่าร้อยละ 5	ไม่ทราบความถี่ของการเกิด
ภาวะภูมิไวเกิน	บวม	ผื่นแดง ผื่นลมพิษ
ระบบทางเดินโลหิต	จำนวนเม็ดเลือดขาวสูง เม็ดเลือดขาวต่ำกว่าปกติ	
ระบบทางเดินอาหาร	ท้องเสีย/อุจจาระเหลว ปากแห้ง ปวดท้อง คลื่นไส้ อาเจียน การรับรสผิดปกติ	ท้องอืด ซากภายในปาก (เช่น ลิ้นและริมฝีปาก)
ตับ	การเพิ่มขึ้นของ AST(GOT) ALT (GPT) ALP gamma-GTP และบิลิรูบิน	
ระบบหลอดเลือดและหัวใจ	ใจสั่น	
ระบบจิตประสาทและจิตใจ อื่นๆ	มึนงง มึนศีรษะเล็กน้อย ปวดศีรษะ รู้สึกไม่สบาย ระดับไตรกลีเซอไรด์สูงขึ้น	ตัวสั่นกระตุก

อันตรกิริยาระหว่างยา

- การให้ยา Gasmotin ร่วมกับยาด้านโคลิเนอจิก ได้แก่ อะโทรปีนซัลเฟต และ บิวทิล-สโคโพลามีน และอื่นๆ อาจทำให้ผลของยา Gasmotin ลดลง ดังนั้น ในกรณีที่ต้องให้รวมกันกับยาด้านโคลิเนอจิก ควรระวังโดยเว้นระยะในการให้ยาอีกตัวหนึ่ง

- การให้ยา Gasmotin ขนาด 15 มิลลิกรัม/วัน ร่วมกับอีริโทรมัยซินที่ขนาด 1200 มิลลิกรัม/วัน เปรียบเทียบกับการให้ mosapride เพียงขนาดเดียว ความเข้มข้นของยาในเลือดสูงสุดของ mosapride เพิ่มขึ้นและ ค่าครึ่งชีวิตยาวนานขึ้น

ข้อควรระวัง

การใช้ยาในสตรีมีครรภ์และสตรีในระยะให้นมบุตร (usage in pregnancy and lactation)

1. ไม่ควรใช้ยานี้ในสตรีมีครรภ์และ สตรีที่มีความเป็นไปได้ว่าจะตั้งครรภ์ นอกจากว่าคุณประโยชน์ทางการรักษาที่คาดว่าจะได้มีมากกว่าความเสี่ยงที่เป็นไปได้ว่าจะเกี่ยวข้องกับ การใช้ยาเพื่อรักษา (ยังไม่มีข้อมูลเกี่ยวกับความปลอดภัยของยาตัวนี้ในสตรีมีครรภ์)

2. ควรหลีกเลี่ยงการให้ยานี้แก่สตรีที่กำลังให้นมบุตร ถ้ามีความจำเป็นต้องให้ยานี้ มารดาควรหยุดให้นมบุตรระหว่างการรักษา [การทดลองในสัตว์ทดลอง (หนูขาว) แสดงให้เห็นว่า ยา นี้ขับออกมาทางน้ำนมได้]

การใช้ยาในเด็ก (Usage in Pediatrics)

ยังไม่มีข้อมูลเกี่ยวกับความปลอดภัยของยา นี้ในเด็ก

การใช้ยาในผู้สูงอายุ

เนื่องจากผู้ป่วยสูงอายุโดยทั่วไปมีการทำงานด้านสรีระของไตและตับลดลง จึงควรให้ยา

นี้ด้วยความระมัดระวังโดยการตรวจสอบภาวะของผู้ป่วย ถ้าพบว่ามีอาการไม่พึงประสงค์เกิดขึ้น ควรใช้มาตรการที่เหมาะสมได้แก่ ลดขนาดยา (เช่น ลดลงถึง 7.5 มิลลิกรัมต่อวัน)

ข้อห้ามใช้

ผู้ป่วยที่แพ้ยานี้หรือแพ้ยาชนิดอื่นในกลุ่ม 5-HT4 receptor agonist

วิธีเก็บรักษาและความคงตัวของยา

- เก็บขวดยาที่ยังไม่เปิดที่อุณหภูมิไม่เกิน 30°C
- อายุการใช้ยา 3 ปี

การศึกษาเปรียบเทียบกับยาอื่นในกลุ่มเดียวกัน

ยา prokinetic ในปัจจุบันมี 5 ชนิดคือ Itopride, Cisapride, Mosapride, Metoclopramide และ Domperidone

Prokinetics อาจแบ่งตามกลไกการออกฤทธิ์ได้เป็น 2 แบบคือ

1. Dopamine D2 receptor antagonist เช่น Itopride, Metoclopramide และ Domperidone ยากลุ่มนี้จะออกฤทธิ์โดยตรงที่ Dopamine D2 receptor ตลอดจนมีผลต่อ cholinesterase ในระบบประสาทส่วนกลางจึงทำให้ผู้ป่วยที่ทานยา ส่วนหนึ่งอาจเกิดผลข้างเคียง เช่น

- Metoclopramide ทำให้เกิดปัญหา extra pyramidal เช่น เกิด dystonic reactions (เกิดอาการแข็งเกร็ง)

- Domperidone ไม่มีปัญหา extra-pyramidal แต่กลับพบปัญหา galactorrhea หรือ gynecomastia (น้ำนมไหลหรือเต้านมโตในผู้ชาย)

2. Serotonin receptor agonist เช่น Cis-

apride, Mosapride ยากลุ่มนี้จะออกฤทธิ์โดยตรงต่อระบบทางเดินอาหาร ที่ GI plexus โดย Mosapride ออกฤทธิ์จำเพาะผ่าน serotonin 5-HT4 receptor ส่วน Cisapride จะมีผลต่อทั้ง 5-HT1,

5-HT3 และ 5-HT4 ซึ่งอาจทำให้เกิดผลข้างเคียงที่รุนแรง เช่น หัวใจเต้นผิดจังหวะ QT prolongation หรืออาจเกิด torsades de pointes

	Prokinetic drugs			
	Cisapride	Mosapride	Metoclopramide	Domperidone
Prokinetic	strong	strong	strong	moderate
Antiemetic	none	none	strong	moderate to strong
Metabolic enzyme pathway	cyp450	cyp450	cyp450	cyp450
QT-prolong	++	-	-	-
Prolactin elevation	rare	rare	rare-moderate	rare-moderate
Extra-pyramidal symptoms	rare	rare	frequent	rare
Mode of action	5-HT4 receptor agonist	5-HT4 receptor agonist	5-HT4 receptor agonist	D2 receptor antagonist
			D2 receptor antagonist	
Organ	upper and lower gut	upper and lower gut	upper gut	upper gut

บรรณานุกรม

1. Charles FL, Lora LA, Morton PG, Leonard LL. Drug information handbook. 15th ed. Lexi-Comp, 2007-2008.
2. Gasmotin® Product Monograph. Eisai Co., Ltd.
3. Kachintorn U. Optimal therapy for functional dyspepsia. International conference on gastroenterology and hepatology 2010. Available : http://www.medicthai.net/picture/news/optimal_therapy_for_functional_dyspepsia.