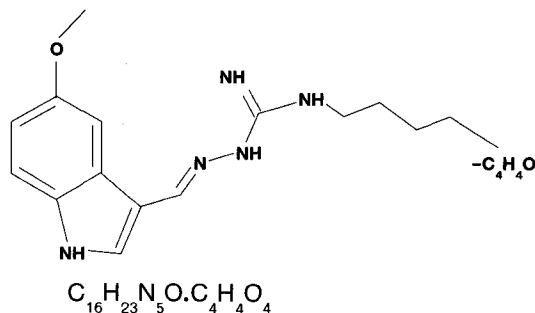


ยานำรู้

Tegaserod

อาทิตยา มหารงค์ ภ.บ.*



รูปที่ 1 โครงสร้างทางเคมี

ชื่อสามัญ	Tegaserod
ชื่อทางเคมี	3-(5-methoxy-1H-indol-3ylmethylene)-N-pentylcarbazimidamide hydrogen maleate
ชื่อการค้า	Zelmac
บริษัทผู้ผลิต	Novartis Pharma Ltd., Basle, Switzerland

กลไกการออกฤทธิ์

(Pharmacologic Action)

Tegaserod เป็นยาในกลุ่ม GI sensorimotor modulator ออกฤทธิ์โดยการกระตุ้นรีเฟล็กซ์บีบตัว (peristaltic reflex) และการคัดหลั่งของลำไส้ รวมทั้ง

การจับไวต่อสิ่งเร้าของอวัยวะในช่องท้อง ด้วยการกระตุ้นแบบ partial agonist ต่อ serotonin type 4 (5-HT₄) receptor ในทางเดินอาหาร โดยทำให้มีการกระตุ้นเพื่อปล่อยสารนำคลื่นประสาท (neurotransmitter) จากเซลล์ประสาทรับความรู้สึก ซึ่งช่วยให้การทำงานของระบบ

* กลุ่มงานเภสัชกรรม โรงพยาบาลพระปกเกล้า จังหวัดจันทบุรี

ทางเดินอาหารของผู้ป่วย irritable bowel syndrome (IBS) กลับสู่ปกติ

เภสัชจลนศาสตร์

(Pharmacokinetics)

- Tegaserod ถูกดูดซึมอย่างรวดเร็ว ความเข้มข้นสูงสุดของยาในพลาสมาพบที่ประมาณ 1 ชั่วโมงหลังกิน

- absolute bioavailability ประมาณร้อยละ 10 ขณะอดอาหาร

- protein binding ร้อยละ 98 อาหารทำให้คุณภาพทางชีวภาพลดลงร้อยละ 40-65

- plasma clearance เท่ากับ 77 ± 15 ลิตร/ชั่วโมง

- terminal half life เท่ากับ 11 ± 5 ชั่วโมง

- ประมาณ 2/3 ของยาที่ได้รับประทานถูกขับออกโดยไม่มีการเปลี่ยนแปลงทางอุจจาระ ที่เหลือ 1/3 ถูกขับออกทางปัสสาวะ โดยมากอยู่ในรูปสำคัญที่ได้จากการเกิด metabolism

ข้อบ่งใช้

(Indication)

ใช้รักษากลุ่มอาการลำไส้แปรปรวน (irritable bowel syndrome) ในเพศหญิงที่มีอาการท้องผูกเป็นอาการเด่น ซึ่งอาจมีอาการปวดท้อง และแน่นท้องร่วมด้วย

ขนาดยาและวิธีใช้

(Dosage and Administration)

กินขนาด 6 มก. 1 เม็ดวันละ 2 ครั้ง ก่อนอาหาร ไม่ต้องปรับขนาดยาในผู้ป่วยสูงอายุ ผู้ป่วยโรคไต ผู้ป่วยโรคตับที่ทำงานบกพร่องเล็กน้อยถึงปานกลาง

อาการไม่พึงประสงค์

(Adverse Drug Reaction)

อาจพบอาการท้องเสียซึ่งส่วนใหญ่เกิดขึ้น

ชั่วคราวในระยะแรก อาการอื่นที่พบได้แก่ ปวดท้อง คลื่นไส้ ท้องเฟ้อ ปวดศีรษะ เวียนศีรษะ ปวดหลัง และอาการคล้ายไข้หวัดใหญ่

ปฏิกิริยากับยาอื่น

(Drug Interaction)

ไม่พบปฏิกิริยากับยาอื่นที่แสดงออกทางคลินิก ดังนั้นจึงไม่ต้องปรับขนาดยาใดๆเมื่อกินร่วมกับยาอื่น

ข้อควรระวัง

(Precaution)

เนื่องจากยังไม่มีการศึกษาถึงความปลอดภัยและประสิทธิภาพยาในผู้ป่วยเด็ก และผู้ป่วยที่ตับทำงานบกพร่องอย่างรุนแรง จึงไม่แนะนำให้ใช้ในกลุ่มนี้

ควรระมัดระวังเป็นพิเศษในผู้ป่วยที่ย่อยน้ำตาลแลคโตสไม่ได้ เนื่องจากในเม็ดยา 1 เม็ดประกอบด้วยแลคโตสประมาณ 38 มิลลิกรัม

บรรณานุกรม

1. Novartis Pharmaceuticals Corporation. Physician Prescribing Information 2002, July. [Online]. Available URL: <http://Zelnorm.com>
2. Gralnek IM, Hays RD, Kilbourne A, Naliboff B, Mayer EA. The impact of irritable bowel syndrome on health-related quality of life. *Gastroenterology* 2000;119:654-660.
3. Prather CM, Camillei M, Zinsmeister AR, McKinze S. Tegaserod accelerates oroceal transit in patients with constipation-predominant irritable bowel syndrome. *Gastroenterology* 2000;118:463-8.
4. Schikowski A, Thewissen M, Mathis C, Ross HG, Enck P. Serotonin type-4 receptors modulate the sensitivity of intramural mechanoreceptive afferents of the cat rectum. *Motil* 2002;14:221-7.

5. Appel-Dingemanse S, Hirschberg V, Osborne S, Pommier F, Mclead J. Multiple-dose pharmacokinetics confirm no accumulation and dose proportionality of novel promotile drug Tegaserod (HTF919). *Eur J Clin Pharmacol* 2001;56:889-91.
6. Vickess AE, Zollinger M, Dannecker R, Tynes R, Heitz F, Fischer V. In vitro metabolism of tegaserod in human liver and intestine assessment of drug interactions *DMD* 2001;29:1269-76.
7. Beglinger C. A Novel, selective 5-HT₄ receptor partial agonist for irritable bowel syndrome. *IJCP* 2002;56:47-51.
8. Muller - Lissener SA, Fumagalli L, Bardhan KD, et al. Tegaserod, a 5-HT₄ receptor partial agonist, relieves symptoms in irritable bowel syndrome patients with abdominal pain, bloating and constipation. *Aliment Pharmacol Ther* 2001;15:1655-66.
9. Camilleri M. Review article. Tegaserod. *Aliment Pharmacol Ther* 2001;15:277-89.
10. Drici MD, Ebert SN, Wang WX, et al. Comparison of Tegaserod (HTF 919) and its main human metabolite with Cisapride and Erythromycin on cardiac repolarization in the isolated rabbit heart. *J Cardiovas Pharmacol* 1999;34:82-8.
11. Ruegg P, Morganroth J, Dunger-Baldauf C, Appel-Dingemanse S, Bliesath H, Lefkowitz ZM. Tegaserod, a 5-HT₄ receptor partial agonist, devoid of significant electrocardiographic effects. *Gastroenterology* 2001. Abstract.
12. Zhou H, Khalilieh S, Svendsen K, et al. Tegaserod (HTF 919) does not affect theophylline Pharmacokinetics (PK) in healthy subjects. *Am J Gastroenterol* 1999;94:2683-184.
13. Kalbag J, Migoya E, Osborne S, et al. Tegaserod does not significantly affect the Pharmacokinetics of Dextromethorphan in healthy subjects. *Gastroenterology* 2000;118:4:A1179, 5422.
14. Ledford P, Un N, Ligueros SM, et al. Tegaserod does not significantly affect Pharmacokinetics and Pharmacodynamics of Warfarin in healthy subjects. *Gastroenterology* 2000;118:4:A1184, 5445.
15. Zhou H, Walter YH, Hubert M, et al. Tegaserod (HTF 919) does not decrease the effectiveness of an oral contraceptive when coadministered to healthy female subjects. *Gastroenterology* 2000;118:4:A1207, 5539.