

I'm not a robot

































Answered by: Dr Chandra M Gulhati | Q: I am 26 years old suffering from GERD for the last five years. I have been on Ganaton (twice a day, morning and night) and Esoz (one tablet in the afternoon after lunch). When should I take Esoz, before or after lunch? Are there any side effects of taking both the drugs? Ganaton was prescribed after I had my endoscopy and Esoz was prescribed by my family doctor. How long should I continue these medicines? A:Ganaton is the trade name of a medicine called itopride while Esoz contains esomeprazole. In correctly diagnosed cases of non-infective GERD (many cases are due to H. pylori infection that requires antibacterial therapy), esomeprazole and other related compounds such as omeprazole, pantoprazole (Pantodac), lansoprazole are the first line therapy that has been found to be beneficial. In about 40% of the non-infective GERD cases, the movement of the gut is found to be sluggish. In such cases, prokinetic (that promote gut movement) agents such as metoclopramide and domperidone are found to be helpful. Itopride is relatively a new prokinetic drug and has not been approved for use in major, advanced countries such as United States, Canada, Britain, etc. Hence, not much research has gone into its efficacy and safety profile (i.e. adverse effects) after prolonged use. Another prokinetic agent called cisapride was banned several years go for causing heart movement abnormalities that led to fatal outcomes. Doctors in advanced countries in the West use metoclopramide or domperidone in those cases of GERD where it may be required.
FORMA FARMACÉUTICA Y FORMULACIÓN: Cada COMPRIMIDO contiene:Clorhidrato de itoprida 50 mg equivalente a 45.4 mg de ItopridaExcipiente cbp 1 comprimido INDICACIONES TERAPÉUTICAS: Itoprida es útil para el tratamiento y alivio de los síntomas derivados de los trastornos directamente relacionados con la dismotilidad gastrointestinal y padecimientos asociados tales como la enfermedad ácido péptica.Itoprida está indicada principalmente para el tratamiento de la enfermedad por reflujo gastroesofágico (ERGE) erosiva y no erosiva, particularmente aquella asociada al reflujo duodeno-gastroesofágico (biliar), en la dispepsia funcional de acuerdo con los criterios diagnósticos de Roma II, tipo dismotilidad y tipo inespecífico o de acuerdo a Roma III, síndrome de malestar post-prandial y síndrome de dolor epigástrico, así como en la gastroparesia idiopática y diabética. Itoprida está indicado como terapia coadyuvante en algunos casos de síndrome de intestino irritable (SII), particularmente en la variante estreñimiento (Roma II y Roma III) y en algunos casos de pacientes con estreñimiento crónico idiopático.Itoprida también es útil en el alivio de algunos síntomas gastrointestinales ocasionales tales como la distensión abdominal, anorexia, plenitud post-prandial, dolor o malestar abdominal por acidez y como coadyuvante en el control de la náusea y/o vómito. FARMACOCINETICA Y FARMACODINAMIA: Itoprida (clorhidrato de itoprida), pertenece al grupo de sustancias derivadas de la amida del ácido benzoico denominadas benzamidas sustituidas. Su nombre químico es: clorhidrato de N- [(4-(2-dimetilaminoetoxi)fenil)metil]-3,4-dimetoxi-benzamida o clorhidrato de N-(p-(2- dimetilamino) etoxil)encil) veratramida.Itoprida es una benzamida sustituida (derivada del ácido benzoico) con propiedades procinéticas particulares, ya que cuenta con un doble mecanismo de acción: actúa como antagonista de los receptores dopaminérgicos tipo D2 y tiene acción inhibitoria selectiva sobre la enzima acetilcolinesterasa.La fórmula molecular condensada es: C20H26N2O4.HCl y presenta un peso molecular de 394.90 g.El clorhidrato de itoprida es una sustancia inodora ligeramente amarga que se presenta en forma de polvo cristalino blanco o casi blanco, el cual es altamente soluble en agua, soluble en ácido acético y metanol, escasamente soluble en etanol y prácticamente insoluble en anhídrido acético. En solución acuosa tiene un pH entre 4.0 y 5.0 y tiene un punto de fusión entre 193 y 198 °C.Itoprida, en diversos estudios, ha demostrado eficacia terapéutica para el tratamiento de pacientes con trastornos de motilidad gastrointestinal, a través de un mecanismo de acción dual. La sinergia de su acción como un antagonista dopaminérgico y de la acción (selectiva, reversible y dependiente de la dosis) inhibitoria de la acetilcolinesterasa, da como resultado un incremento de la motilidad gastrointestinal y favorece el vaciamiento gástrico.Itoprida inhibe tanto la acetilcolinesterasa (AChE) como la butirilcolinesterasa (BuChE); sin embargo, los diferentes ensayos han demostrado que la concentración media de inhibición (IC50) de la itoprida es 100 veces mayor con la AChE que con la BuChE .A diferencia con la neostigmina, la inhibición de la AchE es 10 veces menor. La IC50 de la itoprida con la AchE es 200 veces mayor en la anguila eléctrica y 50 veces mayor en el cobayo que la de la neostigmina.Itoprida, además de su acción sobre la acetilcolinesterasa, es un antagonista dopaminérgico y por lo tanto bloquea la inhibición de la motilidad de la musculatura gástrica inducida por la dopamina de manera dosis-dependiente.Los receptores dopaminérgicos están ligados a proteína G; la diferencia entre estos grupos de receptores radica en el tipo de proteína G y los agentes mensajeros utilizados. Todos los receptores ligados a proteína G constan de una porción extracelular que tiene el grupo amino-terminal, una porción proteínica con 7 dominios que atraviesan la membrana y una porción intracelular que posee la terminación carboxilo que con frecuencia se asocia a un grupo palmitol.Las propiedades fisicoquímicas de Itoprida influyen en su acción in vivo. La afinidad más específica de la itoprida a los receptores periféricos que a los receptores centrales ha sido asociada a su estructura química y a su grado de lipofiliidad; por lo tanto, no se han detectado efectos extrapiramidales clínicamente relevantes al no atravesar la barrera hematoencefálica.Itoprida no interactúa con los receptores 5-HT4, por lo cual no incrementa el intervalo QT.La selectividad y el exclusivo mecanismo de acción de este procinético, claramente lo separa de los compuestos de generaciones anteriores al minimizar el potencial de efectos secundarios y, por lo tanto, proporcionar un perfil de seguridad favorable para obtener mejores resultados de alivio de síntomas relacionados con la hipomotilidad.Itoprida se absorbe rápidamente. La concentración plasmática máxima se alcanza a los 35 minutos después de la administración oral de una dosis de 50 mg y la vida media es de 5.77 ± 0.33 horas. Su absorción no se ve afectada por la ingesta concomitante con alimentos y tiene una biodisponibilidad del 60%.Parámetros farmacocinéticos: Dosis (mg) Cmáx. (µg/ml) Tmáx. (h) AUC0–8 (µg • h/ml) T1/2 (h) 50 0.28 ± 0.02 0.58 ± 0.08 0.75 ± 0.05 5.77 ± 0.33 En ensayos en modelos animales (ratas), se demostró que las concentraciones plasmáticas alcanzaron el máximo nivel en casi todos los órganos y tejidos entre 1 a 2 horas después de la administración oral de una dosis única (5 mg/kg) de Itoprida. Las concentraciones plasmáticas fueron más altas en riñones, intestino delgado, hígado, glándulas suprarrenales y estómago que en sistema nervioso central, por ejemplo, cerebro y médula espinal. La unión a proteínas plasmáticas es del 96%.Itoprida es metabolizada por acción de la flavin-monooxigenasa (FMO1 y FMO3) y su metabolito principal se encuentra en forma de N-óxido. La itoprida carece del riesgo de interacciones con fármacos que se metabolizan en el citocromo P450 (como macrólidos y fármacos antimicóticos) y es muy poco probable que cause arritmias cardíacas o cambios en el ECG, ya que no se metaboliza por la vía del citocromo P450 isoenzima CYP3A4.Su excreción es principalmente por vía urinaria en un 89.4% en 24 horas, 67.5% en forma de N-óxido y 4.14% es eliminado sin cambios. CONTRAINDICACIONES: Itoprida está contraindicada en pacientes con hemorragia gastrointestinal, obstrucción mecánica o perforación intestinal, pacientes con hiperprolactinemia y en pacientes con hipersensibilidad a cualquier componente de la fórmula. No se use en menores de 12 años.No se use durante el embarazo y la lactancia. RESTRICCIONES DE USO DURANTE EL EMBARAZO Y LA LACTANCIA: Itoprida no deberá ser utilizada durante el embarazo ni la lactancia. REACCIONES SECUNDARIAS Y ADVERSAS: El tratamiento con Itoprida ocasionalmente puede producir las siguientes reacciones secundarias y adversas: Clasificación de reacciones secundarias y adversas de acuerdo con su frecuencia según la OMS. Muy común > 1/10 (> 10%); Común > 1/100 y < 1/10 (> 1% y < 10%); Poco común > 1/1,000 y < 1/100 (> 0,1% y < 1%); Raro > 1/10,000 y < 1/1,000 (> 0,01% y < 0,1%); Muy raro