ونلافاکسین

(Velnafaxine)

دسته دارویی: ضد افسرگی

شکل دارویی: کپسول ۷۵ میلی‌گرمی

نحوه عملکرد دارو

ونلافاکسین از لحاظ ساختار شیمیایی یک ضد افسردگی جدید است که نحوه عملکرد آن از طریق مهارکردن نسبتاً اختصاصی برداشت مجدد سروتونین توسط پایانه های عصبی است ولی با دوزهای بالا تا حدودی برداشت مجدد نوراپی نفرین و دوپامین را نیز مهار می کند. یکی از متابولیت های این دارو ، O- دمتیل ونلافاکسین (ODV) است که همانند خود ونلافاکسین ، مهار کننده قوی برداشت مجدد آمین ها است. ونلافاکسین وODV روی گیرنده های موسکارینی ، هیستامینی-H_1 و آدرنرژیک آلفا۱ اثری ندارند. سایر داروهای سایکوتروپیک با اثر روی این سه نوع گیرنده به ترتیب اثرات آنتی کولینرژیک ، سداتیو و اثرات کاردیوواسکولار (قلبی عروقی) ایجاد می کنند.
ونلافاکسین وODV اثر مهارکنندگیMAO را نیز ندارد.

مشخصات فارماکوکینتیکی دارو

ونلافاکسین از دستگاه گوارش بخوبی جذب شده ولی به علت متابولیسم شدید آن در کبد، فقط ۴۵٪ داروی دست نخورده وارد جریان عمومی خون می گردد (بهره دهی بدنی ۴۵ ٪ است) . نیمه عمر حذف ونلافاکسین و ODV به ترتیب ۶ و ۱۲ ساعت است. حجم توزیع دارو و متابولیت فعال آن نیز به ترتیب حدود۱۰و۷ لیتر برای هر کیلوگرم می باشد. این دو به پروتئین های خون حدود۳۰ ٪ متصل می شوند. غلظت حداکثر ونلافاکسین پس از ۵/۵ ساعت و غلظت حداکثر ODV پس از ۹ ساعت ایجاد می شود. وجود غذا در معده بهره دهی بدنی ونلافاکسین را تحت تأثیر قرار نمی دهد.
ونلافاکسین پس از جذب ، در کبد متابولیسم پره سیستمیک داشته و به متابولیت های مختلف تبدیل می گردد که تنها متابولیت فعال آنODV می باشد. در تولید ODV ، CYP_2D_6 دخیل است. در بیمارانی که کمبود CYP_2D_6 دارند غلظت خونی ونلافاکسین افزایش یافته و غلظت خونی ODV کاهش می یابد. راه اصلی دفع ونلافاکسین (۵٪) و متابولیت های آن ، کلیه ها هستند.این دارو از سدجفتی عبور میکند و به شیر مادر شیرده نیز وارد می شود.

موارد و مقدار مصرف دارو در بزرگسالان

۱- درمان بیماری افسردگی ماژور (۷۵ میلی گرم در روز همراه غذا، که می تواند به تدریج تا ۲۲۵ میلی گرم در روز افزایش یابد).

۲- درمان بیماری Generalized anxiety (۷۵ تا ۲۲۵ میلی گرم در روز)
۳- درمان بیماری Social anxiety (۷۵ تا ۲۲۵ میلی گرم در روز)
۴- درمان بیماری پانیک (با یا بدون ترس از فضاهای آزاد) (۷۵ میلی گرم در روز به مدت ۷ روز)
۵- PMDD (کسالت قبل از قاعدگی) و اوتیسم .

موارد منع مصرف

۱- در افراد حساس به ونلافاکسین یا سایر اجزاء فرمولاسیون فراورده
۲- مصرف همزمان با مهارکننده های MAO (درصورت جایگزینی با مهارکننده های MAO ، باید بین قطع درمان و آغاز درمان ۱۴روز فاصله باشد).

عوارض جانبی دارو

در برخی از بیماران ، ممکن است بعضی از عوارض زیر با مصرف ونلافاکسین ایجاد شود:
سردرد، احساس خستگی، تهوع، خشکی دهان، بی اشتهایی، نفخ، سرگیجه، بیخوابی یا خواب آلودگی، بی قراری، لرزش، تعریق، ناتوانی جنسی، هیپرتانسیون، کاهش وزن، خمیازه، اختلالات بینایی.

تداخل اثر

۱- با مصرف همزمان ونلافاکسین و داروهایی که سیستم سروتونرژیک را تحت تأثیر قرار می دهند. (مهارکننده‌های برداشت عصبی سروتونین، لیتیم، تریپتانها، مهارکننده هایMAO) سندرم سروتونین ایجاد میگردد.
۲- مصرف همزمان ونلافاکسین با الکل (اتانول) می تواند سرگیجه، خواب آلودگی و مشکل تمرکز را تشدید نماید.

مصرف دارو در دوران حاملگی و شیردهی

ونلافاکسین در FDA Pregnancy Category در گروه C ، قرار دارد. مصرف این دارو در سه ماهه سوم حاملگی باعث می شود که نوزادان علائمی مثل ترمور، اختلالات خواب و گوارشی نشان دهند. توصیه شده که این بچه ها تا ۴۸ ساعت پس از تولد کاملاً زیر نظر باشند. ونلافاکسین و متابولیت آن از شیر مادر دفع می شوند. تصمیم برای قطع درمان یا قطع شیردهی بر اساس اهمیت دارو برای مادر گرفته می شود.

نکات آموزشی درباره این دارو

۱- در ضمن درمان با ونلافاکسین ، فشارخون بیمار باید بطور منظم زیر نظر باشد زیرا به صورت وابسته به دوز باعث افزایش فشارخون(بویژه فشارخون دیاستولی) می شود و لذا ممکن است کاهش دوز یا قطع درمان لازم باشد.

۲- در بیماران مبتلا به افسردگی ماژور، مصرف ضد افسردگی ها (از جمله ونلافاکسین) گاهی باعث تشدید افسردگی و بوجود آمدن میل به خودکشی در آنها می گردد و لذا بیماران افسرده باید قبل از درمان و در حین درمان زیر نظر باشند.

۳- در عده ای از بیماران تحت درمان با ونلافاکسین ، وزن آنها حدود ۵ ٪ کاهش می یابد. مصرف این دارو همراه با داروهای کاهش دهنده وزن توصیه نمی شود.

۴-گاهی کاهش سدیم خون ویا سندرم ترشح نامناسب هورمون ضدادرار(ADH) با مصرف ونلافاکسین اتفاق می افتد که در افراد مسن ، بیماران تحت درمان با مدرها یا در بیماران Volume depleted مهم می باشند.

۵- برای کاهش اختلال گوارشی همراه غذا مصرف گردد.

۶- بهتر است در دوران حاملگی مصرف نشود.

۷- درصورت مصرف همزمانSt.john ُs Wort ، اثر سداتیو و خواب آوری افزایش می یابد.

مصرف دوز بیش از حد دارو و درمان آن

Overdose ونلافاکسین معمولاً همراه با مصرف همزمان آن با الکل یا لورازپام بوده است . از علائم مهم در این افـراد میتوان به ، سرگیجه ، تهوع ،کرختی دستها و پاها ، تشنج ، طولانی شدن فاصله QT و تاکیکاردی اشاره نمود. درمان مسمومیت شامل اقدامات انجام شده درOverdose ضد افسردگی ها است. اکسیژن رسانی و ونتیلاسیون، زیر نظر داشتن ریتم قلب و نشانه های حیاتی مهم هستند. اقدامات حمایتی و علامتی توصیه شده اند. ایجاد استفراغ توصیه نمی شود. شستشوی معده هرچه زودتر پس از مصرف دارو سودمند واقع می شود. کربن فعال شده باید مورد استفاده قرار گیرد. ایجاد Diuresis و دیالیز چندان سودمند واقع نمی شوند. آنتی دوت اختصاصی برای ونلافاکسین وجود ندارد.

شرایط نگهداری

دارو دور از نور و در دمای کمتر از ۳۰ درجه سانتی گراد نگهداری شود.

نوع بسته‌بندی دارو

جعبه حاوی بلیسترهای۱۰عددی