

دیفنوکسیلات (Diphenoxylate)

دسته دارویی: ضد اسهال ، اویوئید
شکل دارویی: قرص حاوی ۲/۵ میلی گرم دیفنوکسیلات هیدروکلراید و
۰/۰۲۵ میلی گرم آتروپین سولفات

نحوه عملکرد دارو

این فرآورده یک Fixed combination از دیفنوکسیلات و آتروپین است . دیفنوکسیلات یک اویوئید است که می تواند باعث ایجاد وابستگی (Dependency) و افوریا (سرخوشی) گردد و به این جهت تنها مصرف نمی شود.

افزایش آتروپین به دیفنوکسیلات ایجاد یک فرآورده ADF (Abuse Deterrent Formulation) می کند. این نوع فرآورده ها به منظور بازدارندگی از سوء مصرف تولید می شوند و در صورت سوء مصرف از این قرص ها، آتروپین آن خشکی شدید دهان و یبوست و تاری دید ایجاد می کند که اثر ناخوشایندی (aversion) بوده واز سوء مصرف دارو جلوگیری می نماید.

دیفنوکسیلات با تحریک گیرنده مورفینی ((مو)) درپایانه های اعصاب کولینرژیک دستگاه گوارش و در سیستم عصبی مرکزی ، باعث کاهش فعالیت اعصاب کولینرژیک و کاهش آزاد شدن استیل کولین و باعث کاهش intestinal motility می شود.

آتروپین یک آنتی موسکارین است که در این فرآورده با دوز کمتر از دوز درمانی آن و صرفاً به منظور جلوگیری از سوء مصرف بوسیله Overdose عمدی بکار می رود.

مشخصات فارماکوکینتیکی دارو

دیفنوکسیلات از راه خوراکی بخوبی جذب شده و غلظت پیک خونی در عرض ۲-۱ ساعت ایجاد می شود. به سرعت در کبد استریفیه شده و تولید Difenoxin (دی فنوکسین) می کند. دیفنوکسین یا دیفنوکسیلیک اسید ، فعالیت مشابه دیفنوکسیلات دارد. نیمه عمر دیفنوکسیلات ۲/۵ ساعت، نیمه عمر آتروپین ۲/۵ ساعت و نیمه عمر دیفنوکسیلیک اسید ۴/۵ ساعت است. فقط یک درصد دارو دست نخورده از ادرار دفع می شود و بقیه به صورت متابولیت عمدتاً توسط صفرا از مدفوع و به مقدار کمتر از ادرار دفع می شود.

موارد مصرف دارو

- ۱- درمان اسهال (به عنوان داروی ضد اسهال قوی تر از مورفین است).
- ۲- کاهش Ileostomy Discharge .

مقدار و روش مصرف

در ابتدای درمان در بزرگسالان ۵ میلی گرم (۲ قرص) ۴ بار در روز مصرف شده و سپس هر ۴ ساعت یک قرص مصرف می شود. با مصرف دوز زیاد یا Overdose ، بیبوست و در صورت وجود کولون التهابی ، مگاکولون سمی ایجاد می شود.

موارد منع مصرف دارو

- ۱- کولیت شدید (ممکن است Toxic megacolon ایجاد شود).
- ۲- در اسهال ناشی از کولیت اولسراتیو متعاقب مصرف آنتی بیوتیک (مهاری کردن حرکات روده باعث تاخیر در دفع سموم از کولون می شود).
- ۳- اگر علائم Dehydration (مثل خشکی دهان ، تشنگی زیاد ، کم شدن حجم ادرار، سرگیجه) وجود داشته باشد قطع درمان و Rehydration ضروری است.
- ۴- سندرم داون (آتروپین باعث ایجاد میدریاز شدید و زیاد شدن سرعت ضربان قلب می شود).
- ۵- در درمان دیسانتری حاد و وجود تب ، ممکن است آنتی بیوتیک تراپی همراه آن لازم باشد.
- ۶- انسداد دستگاه گوارش
- ۷- احتباس ادراری و هیپرتروفی پروستاتیک

عوارض جانبی دارو

پانکراتیت (درد شکم، درد پشت، کم شدن اشتها و تهوع)، ایلئوس فلجی و مگاکولون سمی (نفخ، بیبوست، کم شدن اشتها، درد شدید معده ، تهوع) ، اثرات آنتی کولینرژیک (خشکی دهان و پوست، تاری دید ، مشکل تخلیه مثانه) و اثرات تضعیفی روی CNS (سرگیجه، خواب آلودگی) ، سردرد ، هیپرترمی ، کرختی دست و پا ، خارش.

تداخل اثر دارو با سایر داروها

- ۱- مصرف توأم دیفنوکسیلات با الکل ، باربیتوراتها و آرام بخش ها باعث تشدید اثر آنها می شود.
- ۲- با مصرف توأم دیفنوکسیلات با مهارکننده های MAO ممکن است کریزهای هیپرتانسیو ایجاد شود.
- ۳- در فرد وابسته به اوپیوئید ها مثل دیفنوکسیلات ، مصرف نالتروکسون باعث تسریع بروز علائم محرومیت (Withdrawal Symptoms) می شود.

۴- مصرف همزمان ضد دردهای اوپیوئید (نارکوتیک) با دیفنوکسیلات ، باعث افزایش خطر یبوست شدید و اثر تضعیفی شدید در CNS می شود.

مصرف دارو در دوران حاملگی و شیردهی

دیفنوکسیلات در FDA Pregnancy Category در گروه C قرار دارد. دیفنوکسیلات، دی فنوکسیلیک اسید و آتروپین هر سه در شیر مادر ترشح می شوند.

نکات آموزشی درباره این دارو

- ۱- قرص دیفنوکسیلات برای درمان اسهال در بچه ها توصیه نمی شود.
- ۲- اطفال و بچه ها به اثرات سمی آتروپین به طور ویژه حساس هستند.
- ۳- با دوز زیاد (۴۰ تا ۶۰ میلی گرم در روز) ایجاد اثرات CNS می کند و لذا پتانسیل برای سوء مصرف و Addiction وجود دارد.

مصرف دوز بیش از حد و روش درمان آن

از علائم مهم Overdose با این فرآورده، ایجاد اثرات آنتی کولینرژیک (تاری دید، اشکال در دید نزدیک، افزایش ضربان قلب، خشکی شدید دهان و گلو و بینی، احساس گرمای شدید و بر افروختگی پوست)، ضعف تنفسی (کوتاه شدن تنفس) ، بیقراری و هیجان غیر عادی و کوما می باشند. برای درمان Overdose ، باید از ایجاد استفراغ، شستشوی معده (اگر استفراغ ایجاد نشود)، کربن فعال شده، تزریق نالوکسون (۰/۴ میلی گرم) و درمانهای حمایتی ، استفاده شود.

شرایط نگهداری دارو

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

نوع بسته بندی دارو

جعبه حاوی بلیسترهای ۲۰ عددی