

ارسوداکسی کولیک اسید (اورزودیول) Ursodeoxycholic acid (Ursodiol)

دسته دارویی: داروی حل کننده سنگ صفراوی

برند داروسازی امین: Ursogard®

شکل دارویی: کپسول های ۳۰۰ میلی گرمی ، قرص های ۵۰۰ میلی گرمی

نحوه عملکرد دارو

اورزودیول یک اسید صفراوی طبیعی است که مقدار نرمال آن ۵٪ کل اسیدهای صفراوی می باشد. اسیدهای صفراوی در کبد تولید و در کیسه صفرا ذخیره می شوند. وقتی اسیدهای صفراوی وارد روده شوند توسط باکتریهای روده متابولیزه شده و اسیدهای صفراوی ثانویه تولید می نمایند. بعنوان مثال چنوداکسی کولیک اسید (چنودیول) در روده تبدیل به اورسوداکسی کولیک اسید (اپی مرچنودیول) می شود. اورسوداکسی کولیک اسید با شکستن میسل های حاوی کلسترول ، سرعت جذب کلسترول را کم و احتمالاً در کبد نیز سنتز کلسترول را کاهش می دهد. کاهش غلظت کلسترول در صفرا باعث تولید صفرايي با املاح صفراوی زیاد می گردد که به جای رسوب دادن کلسترول باعث حل شدن کلسترول می شود. به این جهت ارسوداکسی کولیک اسید برای حل کردن سنگهای صفراوی کلسترولی که مناسب برای جراحی نیستند بکار می رود.

مشخصات فارماکوکینتیکی دارو

جذب اورزودیول از دستگاه گوارش کامل نیست. پس از جذب، از طریق ورید باب وارد کبد شده و متحمل ۵۰٪ استخراج کبدی می شود. پس از کونژوگه شدن در کبد وارد صفرا شده و در کیسه صفرا تغلیظ و نهایتاً موقع خوردن غذا وارد ایلئوم می گردد. حدود ۷۰٪ دارو در خون به پروتئینهای خون متصل می شود. اورزودیول در کبد با گلیسین یا تورین کونژوگه شده و وارد صفرا می گردد. کونژوگه های اورزودیول در روده کوچک توسط آنزیم های روده ای یا آنزیم های باکتریال دکونژوگه شده و اورزودیول آزاد ، ایجاد می کند که جذب مجدد یافته و در کبد مجدداً کونژوگه می شود. اورزودیول عمدتاً از طریق مدفوع دفع می شود. قسمتی از آن که جذب نشده به کولون می رسد و در آنجا تبدیل به اسید لیتوکولیک (Lithocholic Acid) می شود. قسمت کوچکی از این اسید مجدداً جذب و در کبد توسط تورین یا گلیسین کونژوگه می شود. نیمه عمر دارو ۴ تا ۶ روز می باشد. اورزودیول از جفت عبور کرده و احتمالاً وارد شیر مادر نیز می گردد.

موارد مصرف دارو

- ۱- برای حل کردن سنگهای صفراوی غیرکالسیفیه و radiolucent (کوچکتر از ۲۰ میلی متر) که به دلایل مختلف (مثل سن، واکنش ایدیوسنکراتیک با بیهوش کننده ها، کاندیدا) نیاز به جراحی نباشد بکار می رود. حل شدن سنگ صفراوی معمولاً نیاز به درمان چندین ماهه با اورزودیول دارد. در ۵۰٪ بیمارانی که سنگهای صفراوی آنها با این دارو حل شده در عرض ۵ سال ممکن است مجدداً سنگ صفراوی تشکیل شود.
- ۲- برای پیشگیری از ساخته شدن سنگ صفراوی در افراد چاق که در حال لاغر کردن سریع خود می باشد.
- ۳- برای سیروز صفراوی اولیه مصرف می شود.
(اورزودیول تنها داروی تأیید شده توسط FDA برای ادامه درمان سیروز صفراوی اولیه است).

مقدار و روش مصرف دارو

- ۱- برای حل کردن سنگهای صفراوی، از راه خوراکی ۸ تا ۱۰ میلی گرم برای هر کیلوگرم وزن بدن در روز در دو یا سه دوز منقسم مصرف می شود.
- ۲- برای پیشگیری از تشکیل سنگهای صفراوی ۳۰۰ میلی گرم از راه خوراکی دوبار در روز یا ۸ تا ۱۰ میلی گرم برای هر کیلوگرم وزن بدن در روز در دو تا سه دوز منقسم مصرف می شود.
- ۳- برای درمان سیروز صفراوی، ۱۳ تا ۱۵ میلی گرم برای هر کیلوگرم وزن بدن در روز همراه غذا (بصورت ۲ تا ۴ دوز منقسم) مصرف می شود.

موارد منع مصرف دارو

- ۱- در افرادی که به اورزودیول، اسیدهای صفراوی یا سایر اجزاء موجود در فرمولاسیون فراورده حساس باشند.
- ۲- مصرف جهت انحلال سنگهای کلسترول کالسیفیه، سنگهای رادیواپیک و سنگهای رنگدانه صفراوی radiolucent.
- ۳- در بیماران مبتلا به التهاب کیسه صفرا، التهاب مجاری صفراوی و انسداد صفراوی.

عوارض جانبی دارو

با مصرف اورزودیول در برخی بیماران ممکن است بعضی از عوارض جانبی زیر ایجاد شوند: سردرد، احساس خستگی، اختلال در خواب، عوارض پوستی، کرمپ در شکم، احساس سوزش پشت جناغ سینه، یبوست، تهوع، استفراغ، بی اشتها، سرفه، درد مفاصل و درد عضلانی.

تداخل اثر:

- ۱- مصرف همزمان آنتاسیدهای حاوی آلومینیوم و رزین های پائین آورنده چربی خون مثل کله‌تیرامین و کله‌تیبول باعث کاهش جذب اورزودیول می شود.
- ۲- مصرف همزمان کلوفیرات و استروژنها با این دارو، به علت افزایش یافتن کله‌تیرول کبدی باعث کاهش کارایی اورزودیول می شود.

مصرف در دوران حاملگی و شیردهی

اورزودیول در FDA Pregnancy category در گروه B قرار دارد. مشخص نیست که این دارو از شیر مادر دفع می شود یا نه لذا در دوران شیردهی باید با احتیاط مصرف شود.

نکات آموزشی درباره این دارو

- ۱- دارو ۲ تا ۴ بار در روز مصرف می شود.
- ۲- دارو باید به مدت طولانی مصرف شود.
- ۳- کوچک شدن یا حل شدن سنگ های صفراوی باید توسط ultrasound بفواصل ۶ ماه و ۱ سال زیر نظر باشد.
- ۴- در بیماران مبتلا به سیروز صفراوی اولیه که تحت درمان با این دارو باشند تست های فانکشن کبدی مثل گاماگلوتامیل ترانسفراز (GGT)، گاماگلوتامیل ترانس پپتیداز (GGTP)، آسپارات آمینوترانسفراز (AAT) و آلانین آمینوترانسفراز (ALT) و غلظت بیلی روبین خون، باید در سه ماهه اول درمان ماهی یک بار و سپس هر ۶ ماه یک بار اندازه گیری شود. کاهش سریع در این پارامترها نشان دهنده کارایی درمان است و در بیمارانی که پارامترهای یاد شده زیاد شوند درمان باید قطع گردد.
- ۵- سنگ های صفراوی با دارو حل می شوند ولی ممکن است بعداً مجدداً سنگ های صفراوی دیگری تشکیل شوند.

۶- اورزدیول پاسخ سیستم ایمنی مثل فاگوسیتوز توسط سلولهای ایمنی را کاهش می دهد.

شرایط نگهداری دارو

این فراورده باید در جای خشک ، دور از نور و در دمای بین ۱۵ تا ۳۰ درجه سانتی گراد و در بسته بندی اصلی نگهداری شود.

نوع بسته بندی دارو

جعبه حاوی بلیسترهای ۱۰ عددی