ЭНЦЕЛАД

ДАРЫ КАРАЖАТЫН МЕДИЦИНАДА КОЛДОНУУ БОЮНЧА НУСКАМА

Соодадагы аталышы
Энцелад.
Эл аралык патенттелбеген аталышы
Клопидогрел.
Дарынын түрү
Жука чел кабык менен капталган таблеткалар.
Курамы: жука чел кабык менен капталган таблетка төмөнкүлөрдү камтыйт:
Активдүү зат:
Клопидогрел бисульфат USP клопидогрелге туура келет - 75 мг
Көмөкчү заттар: моногидрат лактозасы, микрокристаллдык целлюлоза, прежелатинизирленген крахмал, тазартылган тальк, магний стеараты, кызгылт Опадрай 03B54040.
Жука жабык кызгылт Опадрай 03B54040: HPMC 2910/гипромеллоза, титан диоксиди, макрогол/ПЭГ 400, кызыл темир оксиди.
Сүрөттөмөсү
Эки тарабы тең жалпак, эки тарабы томпогой, тегерек формадагы, кызгылт түстогу жука чел кабык менен капталган таблеткалар.
Фармадарылык тобу
Кан жана кан жаратуучу органдар. Антитромботикалык препараттар. Тромбоциттердин агрегациясынын ингибиторлору, гепаринди кошпогондо. Клопидогрел.
АТХ коду: B01AC04.
Фармакологиялык касиети
Фармакодинамикасы:
Клопидогрел тромбоциттердин агрегациясынын ингибитору болуп саналган активдүү метаболиттердин бирөө продары болуп саналат. Клопидогрелдин активдүү метаболити, тромбоциттердин агрегациясын басандатууга алып келүү менен кийинкисинде GPIIb/IIIa комплексинин АДФ-аркылуу активациясын жана тромбоциттердин P2Y12 рецептору менен АДФ байланышуусун селективдүү ингибирлейт. Кайтарымсыз байланышуудан улам, тромбоциттер жашоосунун бардык кийинки калган мөөнөтүндө (болжол менен 7-10 күн) АДФ өндоп түзөтүүгө кабылдабагыч бойдон калат, ал эми тромбоциттердин нормалдуу функциясын калыбына келтирүү тромбоциттерди жаңылатуунун туура келүүчү ылдамдыгы менен болот.
АДФ айырмаланган агонисттер менен пайда болгон тромбоциттердин агрегациясы, ошондой эле АДФ бошотулган тромбоциттердин күчөтүлгөн активдешүүсүн бөгөттөөнүн эсебинен басаңдатылат.
Активдүү метаболитти пайда кылуу системасынын P450 изоферменттеринин жардамы аркылуу болгондуктан, алардын кээ бирлери полиморфизм менен айырмаланышы мүмкүн же башка препараттар менен басаңдатылышы мүмкүн, тромбоциттердин агрегациясын адекваттуу ингибирлөө бардык эле бейтаптарда болушу мүмкүн эмес.
75 мг дозада клопидогрелди күн сайын кабыл алууда, кабыл алуунун биринчи эле күнүнөн баштап тромбоциттердин АДФ-индуцирленген агрегациясын маанилүү басандатылышы белгиленет, бул 3-7 күндүн ичинде акырындык менен жогорулайт жана андан кийин адаттагы деңгээлге чыгат (тең салмактуулук абалга жеткенде). Тромбоциттердин агрегациясы тең салмактуу абалда орточо 40-60% басандатылат. Клопидогрелди кабыл алууну токтотуудан кийин тромбоциттердин агрегациясы жана кан кетүү убактысы акырындык менен баштапкы деңгээлине кайтып келет, орточо 5 күндүн ичинде.
Клопидогрел кан тамырчалардын атеросклеротикалык жабыркоосу, айрыкча церебралдык, коронарлык же перифериялык артериянын жабыркоосунда каалаган локализацияларда атеротромбоздун өрчүүсүн алдын алууга жөндөмдүү.
Фармакокинетикасы:
Препараттын абсорбциясы жана биожеткиликтүүлүгү жогору. Суткасына 75 мг дозаны кайталап пероралдык кабыл алуудан кийин клопидогрел тезинен синирилет. Плазмадагы негизги биригүүнүн концентрациясы төмөн, кабыл алуудан кийин 2 сааттын ичинде өлчөө чегине жетпейт (0,025 мкг/л). Клопидогрел жана анын негизги айлануучу метаболити кандын плазмасындагы белоктор менен кайтарымдуу байланышат (ылайыгына жараша 98 жана 94%).
Клопидогрел боордо тезинен зат алмашат. Анын негизги метаболити активдүү эмес болуп саналат жана плазмада айлануучу биригүүнүн 85% жакынын түзөт. Плазмада бул метаболиттин Cmax (75 мг кайталанган пероралдык дозаны кабыл алуудан кийин 3 мг/л жакын) кабыл алуудан кийин бир сааттын ичинде байкалат. Негизги метаболиттин кинетикасы (дозага жараша плазмадагы концентрациянын жогорулоосу) клопидогрелдин 50 дөн 150 мг га чейинки дозанын чегинде сызыктуу көз карандылыкты көрсөткөн. Орточо оордуктагы бөйрөк оорулары менен оорулуулар (креатининдин клиренси 30 дан 60 мл/мин чейин) жана дени сак адамдар менен салыштырмалуу бөйрөктүн оор оорулары менен (креатининдин клиренси 5-15 мл/мин) бейтаптарда суткасына 75 мг ды кабыл алуудан кийин плазмада негизги метаболиттин концентрациясы төмөн.
Клопидогрел таасир берүүчү заттын улантуучусу болуп саналат. Анын активдүү метаболити клопидогрелди жана кийинкисинде гидролизди кычкылдандыруу жолу менен пайда болот. Кычкылдандыруучу деңгээл жөнгө салынат, биринчи кезекте, цитохрома изоферменттери менен P450: 2B6 жана 3A4. Активдүү метаболит тромбоцитардык рецепторлор менен тезинен жана кайтарымсыз байланышат жана тромбоциттердин агрегациясын басаңдатат. Плазмада бул метаболит табылбайт.
Препараттын 50% жакыны заара менен бөйрөктөр аркылуу бөлүнүп чыгат жана куюдан кийин 120 сааттын ичинде болжол менен 46% заң менен бөлүнүп чыгат. Негизги метаболиттин T1/2 бир жолку жана кайталап кабыл алуудан кийин 8 саатты түзөт. Бөйрөктөр менен болүнүп чыккан метаболиттердин концентрациялары – 50%.
Колдонууга көрсөтмө
Атеротромботикалык өрчүп кетүүлөргө айлантуу:
- миокард инфаркты менен (көптөн бери бир нече күндөн 35 күнгө чейин), ишемиялык инсульт менен (көптөн бери 7 күндөн 6 айга чейин) же перифериялык артериянын диагносттон өткөрүлгөн окклюзиондук ооруусу менен чоң бейтаптарда;
- курч коронардык синдрому менен чоңдордо:
- ST сегментин жогорулатпастан (туруктуу эмес стенокардия же Q тишчеси жок миокард инфаркты), тери аркылуу коронардык кийлигишүүлөрдө стентирлөө жүргүзүлгөн бейтаптар (ацетилсалицил кислотасы менен айкалышкан);
- ST сегментин жогорулатуу менен (курч миокард инфаркты) медикаментоздук дарылоодо жана тромболизисти жүргүзүү мүмкүнчүлүгү (ацетилсалицил кислотасы менен айкалышкан).
Атеротромботикалык жана тромбоэмболикалык өрчүп кетүүлөрдү алдын алуу, ошондой эле инсульт, жүрөк алдынын фибрилляциясында (жылмыңдаган аритмияда):
- жүрөк алдынын фибрилляциясы менен бейтаптарда (жылмыңдаган аритмия менен), бул эң аз дегенде кан тамыр өрчүп кетүү кооптуулугунун бир факторуна ээ, түз эмес антикоагулянттарды кабыл алалбайт жана кан кетүүнүн өрчүүсүнүн төмөнкү кооптуулугуна ээ (ацетилсалицил кислотасы менен айкалышкан).
Каршы көрсөтмө
- клопидогрелге жогорку сезгичтүүлүк;
- оор боор алсыздыгы;
- курч кан кетүү, мисалы, пептикалык жарадан кан кетүү же баш сөөк ичиндеги кан куюлуу;
- лактозаны сейрек тубаса көтөрө албастык, лактазанын жетишсиздиги жана глюкозо-галактоздук мальабсорбция;
- кош бойлуулук жана баланы эмизүү мезгили;
- 18 жашка чейинки бала курак (колдонуунун коопсуздугу жана натыйжалуулугу аныкталган эмес).
Этияттуулук менен: орто боор алсыздыгы, бул кан кетүүгө жакындыгы болуу мүмкүн (чектелген клиникалык тажрыйба); бөйрөк алсыздыгы (колдонуунун чектелген клиникалык тажрыйбасы); мертинүүлөр, хирургиялык кийлигишүүлөр; кан кетүүнүн өрчүүсүнө жакындыгы бар ооруулар (өзгөчө ашказан-ичеги же көздүн ичиндеги); стероиддик эмес сезгенүүгө каршы препараттарды, ошондой эле, ЦОГ-2 селективдүү ингибиторлорун чогуу бир убакта кабыл алуу; варфаринди, гепаринди, изоферменттин CYP2C19 төмөнкү активдүүлүгү менен бейтаптарда гликопротеиндин IIb/IIIa ингибиторлорлу (аларда сунушталган дозаларда клопидогрелди кабыл алууда клопидогрелдин азыраак активдүү метаболити пайда болот жана анын антиагреганттык таасири алсыз айкын болгон, ушуга байланыштуу жана курч коронардык синдромдо же тери аркылуу коронардык кийлигишүүдө клопидогрелдин адаттагы сунушталган дозасын кабыл алууда, изоферментанын CYP2C19 нормалдуу активдүүлүгү менен бейтаптарга караганда жүрөк кан-тамыр өрчүп кетүү абдан жогорураак жыштыкта болушу мүмкүн).
Кош бойлуулук жана бала эмизүү мезгили:
Кош бойлуулукта каршы көрсөтүлгөн.
Баланы эмизүү мезгилинде кабыл алуу зарылчылыгында баланы эмизүүнү токтотуу жөнүндө маселени чечүү керек.
Колдонуу жолу жана дозалар
Препарат пероралдуу түрдө кабыл алынат.
Таблеткаларды чайнабастан жана майдалабастан бүтүн бойдон суу менен ичүү сунушталат. Препаратты кабыл алуу тамак-ашты ичүү менен көз каранды эмес. Препараттын дозасы жана дарылоо курсунун узактыгы адатта ар бир бейтап үчүн дарыгер тарабынан жекече аныкталат.
Атеротромбозду алдын алуу үчүн чоңдорго жана улгайган курактагы бейтаптарга адатта күнүнө 1 жолу 75 мг препарат (1 таблетка) дайындалат. Миокарда инфарктын башынан өткөрүүдөн кийин алдын алуу максатында препаратты кабыл алуу бир нече күн өткөндөн кийин баштоо керек, бирок 35 күндөн кем эмес, ишемиялык инсультту өткөрүүдөн кийин –1 жума өткөрүп, бирок 6 ай өткөрүүдөн кем эмес.
ST сегментин жогорулатпастан курч коронардык синдром бейтаптарга дарылоонун башында 300 мг препаратты (4 таблеткалар) бир жолудан дайындашат, мындан кийин ацетилсалицил кислотасы менен айкалыштырып күнүнө 1 жолу 75 мг препаратты кабыл алууга өтөт. Ацетилсалицил кислотасынын дозасын дарылоочу дарыгер жекече аныктайт, адатта ал суткасына 75-325 мг ды түзөт, бирок кан кетүүнүн өрчүү кооптулугунун жогорулоосуно байланыштуу 100 мг ацетилсалицил кислотасынын суткалык дозасын ашып кетүү сунушталбайт. Максималдуу дарылык натыйжа дарылоо башталгандан кийин 3 ай өткөндөн кийин белгиленет.
Курч миокард инфарктында адатта дарылоонун башталышында 300 мг препаратты бир жолудан дайындалат, андан кийин ацетилсалицил кислотасы менен айкалыштырып күнүнө 1 жолу 75 мг препаратты кабыл алууга өтөт. 75 жаштан жогорку курактагы бейтаптарды дарылоодо дарылоонун башталышында препараттын катуу дозасын өткөрүү менен, препаратты кабыл алуу суткасына 1 жолу 75 мг препараттан башталат. Дарылоо курсунун узактыгы 4 жумадан аз эмес.
Боор жана/же бөйрөк функцияларынын бузулуулары менен жабыркаган бейтаптарда препараттын дозасын өндоп түзөтүү зарылчылыгы жөнүндө маалыматтар жок.
Кыйыр таасири
Кан жаратуу органдары тарабынан: көп эмес – тромбоцитопения, лейкопения, эозинофилия; сейрек – нейтропения, ошондой эле. айкын; абдан сейрек – тромботикалык тромбоцитопеникалык пурпура, аз кандуулук анын ичинде апластикалык, панцитопения, агранулоцитоз, оор тромбоцитопения, гранулоцитопения.
Аллергиялык реакциялар: абдан сейрек – анафилактикалык реакциялар, сары суу ооруусу.
Нерв системасы тарабынан: көп эмес - баш оору, баш айлануу, парестезиялар, баш сөөк ичинен кан кетүү, ошондой эле өлүмгө алып келген учурлар; сейрек – вертиго; абдан сейрек - акыл эстин айнышы, галлюцинациялар.
Сезүү органдары тарабынан: көп эмес – көздүн конъюнктивасына, торчосуна кан куюлуу; даамдын бузулушу.
Жүрөк кан-тамыр системасы тарабынан: тез-тез – гематома; абдан сейрек – оор кан кетүүлөр, операциялык жарадан кан кетүү, васкулит, артериялык басымдын төмөндөөсү.
Дем алуу системасы тарабынан: абдан сейрек– мурундан кан кетүү; абдан сейрек – колко карышуусу, интерстициалдык пневмонит, өпкөдөн кан кетүү, кан какыруу.
Тамак-аш сиңирүү системасы тарабынан: тез-тез – ич өтүү, ичтин оорусу, диспепсия, АИЖ кан кетүү; көп эмес – 12 эли ичеги ашказандын жарасы, гастрит, кусуу, көңүл айнуу, ич катуу, метеоризм; сейрек – көңдөйлөрдөн кан кетүү; абдан сейрек – панкреатит, колит, анын ичинде жара же лимфоцитардык, стоматит, курч боор алсыздыгы, гепатит, боордун функционалдык сынамынын бузулушу, өлүмгө алып келүү менен АИЖ кан кетүү.
Тери катмарлары тарабынан: тез-тез – тери алдынан кан куюлуу; көп эмес - тери бөртмөсү, кычышуу, пурпура; абдан сейрек – ангионевротикалык шишимик, бөрү жатыш, эритематоздук бөртмө, көп түрлүү эритема, Стивенса-Джонсондун синдрому, токсиндүү эпидермалдык некролиз, экзема, кызыл жалпак чакалай.
Таяныч-кыймылдатуучу аппарат тарабынан: абдан сейрек – гемартроз, артрит, артралгия, миалгия.
Заара жыныс системасы тарабынан: көп эмес – гематурия; абдан сейрек – гломерулонефрит, гиперкреатининемия.
Башкалар: абдан сейрек – калтырак басуу.
Ашыкча доза
Симптомдору: ашыкча доза кан кетүү убактысынан жогорулоосуно кийинкисинде кан кетүүнүн өрчүүсү сыяктуу өрчүп кетүүлөргө алып келиши мүмкүн.
Дарылоо: кан кетүү пайда болгондо туура келүүчү дарылоо иш чаралар талап кылынат. Клопидогрелдин антидоту аныкталган эмес. Эгерде кан кетүүнүн узарып кеткен убактысын тезинен өндоп түзөтүү зарыл болсо, анда тромбоцитардык массаны куюуну жүргүзүү сунушталат.
Башка дары препараттар менен өз ара таасири
Препаратты ацетилсалицил кислотасы менен чогуу бир убакта колдонууда тромбоциттердин агрегациясынын таасиринин өз ара күчөп кетүүсү белгиленет. Бул препараттар менен айкалышкан дарылоонун коопсуздугу 12 айдан көбүрөөк убакыттын ичинде аныкталган эмес.
Препаратты гепарин менен этияттуулук менен колдонуу керек, бирок клопидогрелди гепарин менен дарылануу алып жаткан бейтаптарга дайындоо акырлардын дозасын өндоп түзөтүүнү талап кылбайт.
Башка тромболитикалык дары каражаттарын кабыл алуучу бейтаптарга препаратты дайындоодо, этияттуулукту сактоо керек.
Клопидогрелди варфарин менен чогуу бир убакта кабыл алууда кан кетүүнүн өрчүүсүнүн кооптуулугу жогорулашы мүмкүн. Клопидогрелди варфарин менен дарылануу алып жаткан бейтаптарга дайындоого болбойт.
Препаратты плазманын белоктору менен байланышуунун жогорку деңгээлине ээ болгон дары каражаттары менен этияттуулукта дайындоо керек.
Препаратты стероиддик эмес сезгенүүгө каршы препараттар менен чогуу бир убакта дайындоодо этияттуулукту сактоо керек.
Препаратты антацидик дары каражаттар менен чогуу бир убакта колдонууда клопидогрелдин фармакокинетикасынын көрсөткүчтөрүнүн өзгөрүүсү белгиленген эмес.
Энцелад препаратын гликопротеиндин IIb/IIIa ингибиторлорун кабыл алуучу бейтаптарга дайындоодо этияттуулукту сактоо керек.
Өзгөчө көрсөтмөлөр
Энцелад препараты менен дарылануунун биринчи жумасы ичинде жана/же инвазивдүү кардиологиялык процедурадан кийин/хирургиялык кийлигишүүдөн кийин, кан кетүү белгилерин көшпогондо, анын ичинде жабык нерсеге бейтаптарга дыкат байкоо жүргүзүү керек.
Кан кетүүнүн пайда болуусуна шектүү болгон, клиникалык симптомдорду дарылоонун жүрүшүндө пайда болуу учурда гематологиялык жагымсыз натыйжалардын жана кан кетүүнүн өрчүү кооптуулугуна байланыштуу, тезинен кандын клиникалык анализин жүргүзүү керек, АЧТВ, тромбоциттердин саны, тромбоциттердин функционалдык активдүүлүгүнүн көрсөткүчтөрүн аныктоо жана башка керектүү изилдөөлөрдү жүргүзүү.
Энцеладты, ошондой эле, башка антитромбоцитардык препараттар сыяктуу эле, мертинүүлөр менен, хирургиялык кийлигишүүлөр менен же башка патологиялык абалдар менен байланыштуу, ошондой эле ацетилсалицил кислотасын, стероиддик эмес сезгенүүгө каршы препараттарды, ошондой эле, ЦОГ-2 ингибиторлору, гепарин же гликопротеиндин IIb/IIIa ингибиторлорун кабыл алган оорулууларда, кан кетүүнүн жогорку кооптуулугуна ээ оорулууларга этияттуулук менен колдонуу керек.
Клопидогрелди варфарин менен чогуу бир убакта колдонуу кан кетүү кооптуулугун жогорулатышы мүмкүн, ошондуктан клопидогрелди жана варфаринди чогуу бир убакта колдонууда этияттуулукту сактоо керек.
Этерде оорулууга пландалган хирургиялык операция жасала турган болсо, жана ошол эле мезгилде антитромбоцитардык натыйжага зарылчылык жок болсо, анда операцияга чейин 5-7 күн мурун Энцелад препаратын токтотуу керек.
Энцелад кан кетүү убактысын узартат жана кан кетүүнүн өрчүүсүнө жакындыгы болгон оорулар менен оорулууларга этияттуулук менен дайындоо керек (өзгөчө, ашказан-ичеги жана көздүн ичи). Клопидогрел кабыл алган бейтаптарда ашказан-ичеги жолунун былжырлуу чел кабыгынын жабыркоосуна алып келүүчү препараттарды (ацетилсалицил кислотасы, стероиддик эмес сезгенүүгө каршы препараттар) этияттуулук менен колдонуу керек.
Оорулуулар кан кетүүнү токтотуу үчүн Энцелад (жалгыз же ацетилсалицил кислотасы менен айкалыштырып) препаратын кабыл алууда көп убакыт керек экендиги тууралуу, ошондой эле аларда адаттан тыш кан кетүүнүн (локализациялоо же улантуу боюнча) пайда болуу учурларында алар өзүнүн дарылап жаткан дарыгерине кайрылуусу керек экендиги жөнүндө эскертилиши керек. Бардык боло турган операциянын алдында жана каалаган башка жаңы дары препаратын кабыл алуунун алдында оорулуулар дарыгерге (ошондой эле стоматологко) Энцелад препаратын кабыл алуусу жөнүндө маалымдашы керек.
Клопидогрелди кабыл алуудан кийин (кээде узак убакытка эмес болгондо да) абдан сейрек тромботикалык тромбоцитопеникалык пурпуралардын (ТТП) өрчүгөн учурлары белгиленген, бул неврологиялык бузулуулар менен, бөйрөк функциясынын бузулуусу жана калтырак басуу менен коштолгон, тромбоцитопения менен жана микроангиопатикалык гемолитикалык аз кандуулук менен мүнөздөлөт. ТТП, ошондой эле плазмаферез тезинен дарылоону талап кылуучу потенциалдык жашоого коркунуч алып келүүчү абал болуп саналат.
Дарылоо мезгилинде боордун функционалдык активдүүлүгүн көзөмөлдөп туруу керек. Боордун оор жабыркоолорунда геморрагиялык диатездин өрчүү кооптуулугу жөнүндө эске алуу керек.
Клопидогрелди кабыл алуу 7 күндөн аз болбогон курч инсультта сунушталбайт (анткени бул абалда аны кабыл алуу боюнча маалыматтар жок).
Унаа каражаттарды же кыймылдын башка потенциалдык кооптуу түрлөрүн башкарууга таасири:
Авто унаа айдоо же кыймылдын башка потенциалдык кооптуу түрлөрү менен алектенүү үчүн зарыл болгон жөндөмдүүлүккө олуттуу таасир көрсөтпөйт.
Чыгаруу формасы
Алу-Алу ар бир блистерде жука чел кабык менен капталган 10 таблетка.
3 блистер медицинада колдонуу боюнча нускамасы менен бирге картон таңгакчага салынган.
Сактоо шарты
25°C дан жогору эмес аба табында кургак, жарыктан корголгон жерде сактоо керек.
Балдар жетпеген жерде сактоо керек.
Жарактуулук мөөнөтү
2 жыл. Жарактуулук мөөнөтү аяктагандан кийин колдонууга болбойт.
Берүү шарты
Дарыгердин рецепти боюнча.

Vegapharm

Үчүн өндүрүлгөн/Manufactured for:
Vegapharm LLP
Astra House, Arklow Road,
London, England SE14 6EB, UK (Улуу Британия)

Өндүрүүчү/Manufactured by:
Ind-Swift Limited
Off. NH-21, Village Jawaharpur,
Tehsil Derabassi, District SAS Nagar (Mohali),
Punjab-140507, India (Индия)

Кыргыз Республикасынын аймагында өндүрүмдүн (товардын) сапаты боюнча керектөөчүлөрдөн арыз-доолорду кабыл алуучу уюмдун дареги:
«Aman Pharm» (Аман Фарм) ЖЧК, Кыргызстан Республикасы, Бишкек шаары, Шоорукова көч., 36.
Тел: (0312) 560466, E-mail: aman.pharm12@gmail.com