РОЗАКЕТ

ДАРЫ КАРАЖАТЫН МЕДИЦИНАДА КОЛДОНУУ БОЮНЧА НУСКАМА

Соодадагы аталышы
Розакет
Эл аралык паттенттелбеген аталышы
Кеторолак
Дарынын түрү
Дисперсияланган таблеткалар
Курамы
Ар бир дисперсияланган таблетка төмөнкүлөрдү камтыйт
Активдүү зат:
Кеторолак трометамин USP 10 мг
Көмөкчү заттар: микрокристаллдуу целлюлоза (PH-112), лактоза моногидраты, коллоиддүү суусуз кремний диоксиди, натрий кроскармеллозасы, натрий крахмал гликоляты (А-тиби), жүгөрү крахмалы, хинолин сары боёгучу, аспартам, тазартылган тальк, магний стеараты, жемиш аралашмасы жыт бергичи.
Сүрөттөмөсү
Капталбаган, ачык сары түстөгү, тегерек, жалпак, бир тарабында сызыгы бар дисперсияланган таблеткалар.
Фармадарылык тобу
Стероиддик эмес сезгенүүгө каршы жана ревматизмге каршы препараттар. Уксус кислотасынан алынгандар жана түрдөш кошундулар.
АТХ коду: M01AB15.
Фармакологиялык касиети
Фармакодинамикасы
Кеторолак айкын ооруну басаңдатуучу таасир берет, ошондой эле сезгенүүгө каршы жана орточо дене ысыгын түшүрүүчү таасирге да ээ. Таасир берүү механизми 1 жана 2 циклооксигеназанын ферментинин активдүүлүгүн, негизинен четки ткандарда селективдүү эмес басуу менен байланышкан, мунун натыйжасы простагландиндердин – оору сезгичтиктин, жылуулукту жөнгө салуунун жана сезгенүүнүн модуляторлорунун биосинтезин токтотуу болуп эсептелинет. Кеторолак [-]S жана [+]R энантиомерлердин рацемиялык аралашмасынан турат, муну менен бирге ооруксуздандыруу таасири [-]S формасы менен шартталган.
Препарат опиоиддик рецепторлорго таасир бербейт, дем алууну баспайт, дарыга көз карандылыкты пайда кылбайт, тынч алдыруучу жана анксиолитикалык таасирге ээ эмес.
Ооруну басаңдатуучу таасиринин күчү боюнча морфинге салыштырууга болот, башка ССКК бир кыйла ашып түшөт.
Ичип кабыл алгандан кийин ооруксуздандыруучу таасиринин башталышы ылайыгына жараша 0,5 жана 1 сааттан кийин байкалат, эң жогорку таасирине 1-2 саат өткөндөн кийин жетет.
Фармакокинетикасы
Ичип кабыл алгандан кийин кеторолак ашказан-ичеги жолунда жакшы сиңет – кандын плазмасында эң жогорку концентрациясына (C_{max}) (0,7-1,1 мкг/мл) 10 мг дозаны ачкарын кабыл алгандан 40 минута өткөндөн кийин жетет. Майы көп тамак канда препараттын эң жогорку концентрациясын төмөндөтөт жана ага жетүүсүн 1 саатка кечиктирет. Препараттын 99% кандын плазма белоктору менен байланышат жана гипоальбуминемияда канда эркин заттардын саны көбөйөт. Биожеткиликтүүлүгү – 80-100%. Пероралдык куюуда тең салмактуу концентрацияга (Css) жетүү убактысы – суткасына 4 жолу дайындоодо 24 саат жана 10 мг – 0,39-0,79 мкг/мл түзөт. Бөлүштүрүү көлөмү 0,15-0,33 л/кг түзөт. Бөйрөк алсыздыгы бар бейтаптарда препаратты бөлүштүрүү көлөмү 2 эсеге, ал эми анын R-энантиомерин бөлүштүрүү көлөмү – 20% көбөйөт.
Эне сүтүнө бөлүнөт: эне 10 мг кеторолакты кабыл алгандан кийин, сүттө Cmax биринчи дозаны кабыл алгандан 2 саат өткөндөн кийин жетет жана 7,3 нг/мл түзөт, кеторолактын экинчи дозасын колдонгондон (препаратты суткасына 4 жолу колдонууда) 2 саат өткөндөн кийин – 7,9 нг/л түзөт.
Куюлган дозанын 50% ашыгы фармакологиялык активдүү эмес метаболиттерди түзүү аркылуу боордо зат алмашат. Негизги метаболиттер глюкурониддер жана р-гидроксикеторолак болуп эсептелет, алар бөйрөк аркылуу бөлүнүп чыгат. 91% - бөйрөк, 6% - ичеги аркылуу бөлүнүп чыгат.
Бөйрөк функциясы нормалдуу болгон бейтаптарда жарым-жартылай бөлүп чыгаруу мезгили (T1/2) орто эсеп менен 5,3 саатты (10 мг ичип кабыл алгандан кийин 2,4 - 9 саатты) түзөт. T1/2 улгайган бейтаптарда узарат жана жаштарда кыскарат. Боордун функциясы T1/2 таасирин тийгизбейт. Бөйрөк функциясынын бузулушу бар бейтаптарда кандын плазмасында креатининдин концентрациясы 19-50 мг/л (168 - 442 мкмоль/л) болсо, T1/2 10,3 - 10,8 саатты, айкын бөйрөк алсыздыгында – 13.6 саатты түзөт.
Жалпы клиренси 10 мг ичип кабыл алууда – 0,025 л/кг/с түзөт; кан плазмасында креатинин концентрациясы 19-50 мг/л болгон бөйрөк алсыздыгында 10 мг ичип кабыл алууда – 0,016 л/кг/с түзөт.
Гемодиализдин жүрүшүндө чыгарылбайт.
Колдонууга көрсөтмө
Орто же күчтүү билинген оору синдрому, анын ичинде операциядан кийинки мезгилде (көңдөйлүк, гинекологиялык, ортопедиялык, урологиялык жана башка операциялардан кийин), мертинүүлөрдөгү (чыгып кетүү, сынып кетүү, үзүлүп кетүү жана байламталардын чоюлушу) оору синдрому, остеоартроздогу, остеохондроздогу, ревматизм ооруларындагы, миалгиядагы, артралгиядагы, радикулиттеги, невралгиядагы оору синдрому, онкологиялык ооруларындагы оору, тиш оору, стоматологиялык кийлигишүүлөрдөн кийинки, перикорониттеги, тиштин жумшак затындагы оору, аркадагы жана булчуңдардагы оору.
Каршы көрсөтмө
Кеторолакка же башка стероиддик эмес сезгенүүгө каршы каражаттарга жогорку сезгичтик, «аспирин» астмасы, колко кысылуусу, ангионевротикалык шишимик, гиповолемия (аны пайда кылган себебинен көз карандысыз), дегидратация.
Күчөө баскычындагы ашказан-ичеги жолунун эрозиялык-жара жабыркоосу, пептикалык жаралар, гипокоагуляция (анын ичинде гемофилия).
Боор жана/же бөйрөк алсыздыгы (плазманын креатинини 50 мг/л жогору).
Геморрагиялык инсульт (такталган же шектелген), геморрагиялык диатез, башка ССКК менен бир убакта кабыл алуу, кан агуунун өрчүшүнүн же кайталанышынын жогорку коркунучу (анын ичинде операциядан кийинки), кан жаратуунун бузулушу.
Препарат кан агууну жогору коркунучунан улам хирургиялык операциялардын алдында жана учурунда ооруну басуу үчүн, ошондой эле өнөкөт ооруларды дарылоо үчүн колдонулбайт.
Этияттык менен – колко астмасы; холецистит; өнөкөт жүрөк жетишсиздиги; артериялык гипертензия; бөйрөк функциясынын бузулуусу (плазма креатинини 50 мг/л төмөн); холестаз; активдүү гепатит; сепсис; системалуу канчоо; улгайган курак (65 жаштан жогору); мурундун жана мурун-кулкун көңдөйүнүн былжыр челинде өсүндүлөр.
Колдонуу жолу жана дозасы
Таблетка түрүндө Розакет оору синдромунун оордугуна жараша бир жолу же кайталанып ичилет. Бир жолку доза – 10 мг, кайталап кабыл алууда оорунун айкындыгына жараша суткасына 4 жолу 10 мг кабыл алуу сунушталат; эң жогорку суткалык доза 40 мг ашпашы керек.
Ичип кабыл алууда курстун узактыгы 5 күндөн ашпоого тийиш.
Препаратты парентералдык куюудан аны ичип кабыл алууга өткөрүүдө эки дары түрүнүн тең жалпы суткалык дозасы өткөрүү күнүндө 65 жашка чейинки бейтаптар үчүн - 90 мг жана 65 жаштан жогорку же бөйрөк функциясы бузулган бейтаптар үчүн – 60 мг ашпашы керек. Муну менен бирге таблеткадагы препараттын дозасы өткөрүү күнүндө 30 мг ашпашы керек.
Кыйыр таасири
Тез-тез – 3% ашык, көп эмес – 1-3%, сейрек – 1% аз.
Тамак сиңирүү системасы тарабынан: тез-тез (айрыкча таржымалында ашказан-ичеги жолунун эрозиялык-жара жабыркоосу бар 65 жаштан жогорку улгайган бейтаптарда) – гастралгия, ич өтүү; көп эмес – стоматит, ич көбүү, ич катуу, кусуу, ашказандын өтө толуп кетүүсүн сезүү; сейрек – окшуу, ашказан-ичеги жолунун эрозиялык-жара жабыркоосу (анын ичинде тешилүү жана/же кан агуу менен – абдоминалдык оору, курсактын үстү жагында тырышуу же ачышуу, мелена, «кофе тунмасы» тибиндеги кусуу, окшуу, зарна ж.б.), холестатикалык сарык, гепатит, гепатомегалия, курч панкреатит,
Зааранды бөлүп чыгаруу системасы тарабынан: сейрек – курч бөйрөк алсыздыгы, гематуриясы жана/же азотемиясы бар же жок белдин оорушу, гемолитикалык уремиялык синдром (гемолитикалык аз кандуулук, бөйрөк алсыздыгы, тромбоцитопения, пурпура), бат-бат заара ушатуу, зааранын көлөмүнүн көбөйүшү же азайышы, нефрит, бөйрөк генезиндеги шишимиктер.
Сезүү органдары тарабынан: сейрек – угуунун начарлашы, кулактын чуулдашы, көрүүнүн бузулушу (анын ичинде көрүп кабыл алуунун даана эместиги).
Дем алуу системасы тарабынан: сейрек – колко кысылуусу же диспноэ, ринит, коконун шишимиги (энтигүү, дем алуунун кыйындашы).
БНС тарабынан: тез-тез – баш оору, баш айлануу, уйку келүү; сейрек – асептикалык менингит (калтыратма, катуу баш оору, карышуу, моюндун жана/же арканын булчуңдарынын катып калуусу), гиперактивдүүлүк (маанайдын өзгөрүшү, тынчсыздануу), галлюцинация, депрессия, психоз.
Жүрөк-кан тамыр системасы тарабынан: көп эмес – АБ жогорулашы; сейрек – өпкөнүн шишимиги, эстен тануу.
Кан жаратуу органдары тарабынан: сейрек – аз кандуулук, эозинофилия, лейкопения.
Гемостаз системасы тарабынан: сейрек – операциядан кийинки жарааттан кан агуу, мурундан кан агуу, көтөн чучуктан кан агуу.
Тери катмарлары тарабынан: көп эмес – тери бөртмөсү (макулопапуллездук бөртмөнү кошо алганда), пурпура; сейрек – эксфолиативдик дерматит (чыйрыгуусу бар же жок калтыратма, теринин кызаруусу, катууланышы же түлөөсү, таңдай бездеринин шишүүсү жана/же оорутуусу), бөрү жатыш, Стивенс-Джонсон синдрому, Лайелла синдрому.
Жергиликтүү реакциялар: көп эмес – куюу жериндеги ачышуу же ооруу.
Аллергиялык реакциялар: сейрек – анафилаксия же анафилактоиддик реакциялар (беттин терисинин өңүнүн өзгөрүшү, тери бөртмөсү, бөрү жатыш, теринин кычышуусу, тахипноэ же диспноэ, кабактардын шишимиги, периорбиталдык шишимик, энтигүү, демдин кысылуусу, көкүрөк клеткасында оордук, ышкырып дем алуу).
Башка: тез-тез – шишимиктер (беттин, шыйрактын, кызыл ашыктын томугунун, бармактардын, тамандардын, дененин салмагынын жогорулашы); көп эмес – өтө терчилдик; сейрек – тилдин шишимиги, калтыратма.
Ашыкча доза
Бир жолку же кайталап колдонууда Розакет препаратын дозасынан ашыруу адатта ич жактын оорушунан, окшуудан, кусуудан, ашказандын пептикалык жараларынын же эрозиялык гастриттин пайда болушунан, бөйрөк функциясынын бузулушунан, гипервентиляциядан билинет. Бул учурларда ашказанды жууп-тазалоо, адсорбенттерди (активдешкен көмүр) куюу жана оору белгилерин жоготууга багытталган дарылоону жүргүзүү сунушталат. Розакет диализдин жардамы менен жетишерлик деңгээлде чыгарылбайт.
Башка дары каражаттары менен өз ара таасири
Кеторолакты ацетилсалицил кислотасы же башка стероиддик эмес сезгенүүгө каршы препараттар, кальций препараттары, глюкокортикостероиддер, этанол, кортикотропин менен бир убакта колдонуу ашказан-ичеги жолунун жараларынын түзүлүүсүнө жана ашказан-ичегиден кан агуунун өрчүшүнө алып келиши мүмкүн.
Парацетамол менен бирге дайындоо нефротоксиндүүлүктү, метотрексат менен – гепато- жана нефротоксиндүүлүктү жогорулатат. Кеторолак менен метотрексатты бирге дайындоо акыркынын төмөнкү дозаларын колдонууда гана мүмкүн болот (кандын плазмасында метотрексаттын концентрациясын көзөмөлдөө).
Пробеницид кеторолактын плазмалык клиренсин жана бөлүштүрүү көлөмүн азайтат, кандын плазмасында анын концентрациясын жогорулатат жана аны жарым-жартылай бөлүп чыгаруу мезгилин көбөйтөт. Кеторолакты колдонуунун фонунда метотрексаттын жана литийдин клиренси азайышы жана бул заттардын токсиндүүлүгү күчөшү мүмкүн. Кыйыр антикоагулянттар, гепарин, тромболитиктер, антиагреганттар, цефоперазон, цефотетан жана пентоксифиллин менен бир убакта дайындоо кан агуунун пайда болуу коркунучун жогорулатат. Гипотензиялык жана диуретиктик препараттардын таасирин төмөндөтөт (бөйрөктө простагландиндердин синтези төмөндөйт). Опиоиддик анальгетиктер менен айкалыштырууда акыркылардын дозасы кыйла төмөндөшү мүмкүн.
Антациддик каражаттар дарынын толук сиңүүсүнө таасир бербейт.
Инсулиндин жана пероралдуу гипогликемиялык препараттардын гипогликемиялык таасири жогорулайт (дозаны кайра эсептөө зарыл).
Натрий вальпроаты менен бирге дайындоо тромбоциттердин биригүүсүнүн бузулушун пайда кылат. Кандын плазмасында верапамилдин жана нифедипиндин концентрациясын жогорулатат.
Башка нефротоксиндүү дары каражаттары (анын ичинде алтындын препараттары) менен дайындоодо нефротоксиндүүлүктүн өрчүү коркунучу жогорулайт. Каналдык бөлүп чыгарууну тосуучу дары каражаттары кеторолактын клиренсин төмөндөтөт жана кандын плазмасында анын концентрациясын жогорулатат.
Өзгөчө көрсөтмө
Тромбоциттердин биригүүсүнө тийгизген таасири 24-48 сааттан кийин токтойт. Гиповолемия бөйрөк тарабынан кыйыр реакциялардын өрчүү коркунучун жогорулатат. Зарылдыгына жараша наркотикалык анальгетиктер менен айкалыштырып дайындоого болот. Розакетти акушердик практикада дары менен операцияга даярдоо, колдоочу анестезия жана ооруксуздандыруу үчүн каражат катарында колдонуу сунушталбайт. Парацетамол менен бир убакта 5 күндөн ашык колдонууга болбойт.
Кандын уюшунун бузулушу бар бейтаптарга препарат тромбоциттердин саны дайыма көзөмөлдөнүп турганда гана дайындалат, бул кандын токтошун кылдаттык менен көзөмөлдөө талап кылынган операциядан кийинки мезгилде өтө маанилүү.
Розакет препаратын дайындоодо бейтаптардын көпчүлүк бөлүгүндө борбордук нерв системасы тарабынан кыйыр таасирлер (уйку келүү, баш айлануу, баш оору), өрчүгөндүктөн, жогорку көңүл бурууну жана тез реакцияны (автоунааны айдоо, механизмдер менен иштөө ж.б.) талап кылган иштерди аткаруудан алыс болуу сунушталат.
Чыгаруу формасы
Блистерде 10 дисперсияланган таблетка.
10 блистер колдонуу боюнча нускама менен бирге картон таңгакта.
Сактоо шарты
Кургак жана жарык тийбеген жерде, 25°С дан жогору эмес аба табында сакталат.
Балдар жетпеген жерде сактоо керек.
Жарактуулук мөөнөтү
3 жыл.
Жарактуулук мөөнөтү бүткөндөн кийин дарыны колдонууга болбойт.
Берүү шарты
Рецепт боюнча.

Соода маркасынын жана каттоо күбөлүгүнүн ээси:
Vegapharm LLP
Unit 18, 53 Norman Road, Greenwich Centre Business Park,
London, England, SE10 9QF, Улуу Британия
Өндүрүүчү:
UNIMAX LABORATORIES
Plot No.7, Sector 24, Faridabad-121 005,
Haryana, Индия
Кыргыз Республикасынын аймагында продукциянын (товардын) сапаты боюнча керектөөчүлөрдөн дооматтарды кабыл алуучу уюмдун дареги:
«Аман Фарм» ЖЧК, Кыргыз Республикасы, Бишкек шаары, Тыныстанов көч, 4а үй, 11-батир
E-mail: aman.pharm 12@gmail.com