«MA'QULLANGAN»
O'zbekiston Respublikasi Sog'liqni saqlash vazirligi huzuridagi Farmatsevtika tarmog'ini rivojlantirish agentligining «Dori vositalari, tibbiy buyumlar va tibbiy texnika ekspertizasi va standartlashtirish davlat markazi» DUK
«19» 11 2020y. №24

ТИББИЁТДА ҚЎЛЛАНИЛИШИГА ДОИР ЙЎРИҚНОМА
КЮПЕН ФОРТЕ

Препаратнинг савдо номи: Кюпен Форте
Таъсир этувчи моддалар (ХПН): кеторолак
Дори шакли: инъекций учун эритма
Таркиби:
1 мл инъекция учун эритма қуйидагиларни сақлайди:
фаол модда: кеторолак трометамини – 30 мг;
ёрдамчи моддалар: бир асосли калий фосфати, икки асосли натрий фосфати, натрий эдетати, натрий гидроксиди, пропиленгликоль, инъекция учун сув.
Таърифи: рангсиз ёки оч сариқ рангли эритма.
Фармакотерапевтик гуруҳи: ностероид яллиғланишга қарши восита.
АТХ коди: M01AB15

Фармакологик хусусиятлари

Фармакодинамикаси

Кеторолак – ностероид ялллиғланишга қарши препарат бўлиб, пирролизин-карбоксил кислотасининг ҳосиласидир. Яққол ифодаланган оғриқ қолдирувчи таъсир кўрсатади, шунингдек яллиғланишга қарши ва иситмани ўртача даражада туширувчи таъсирларга ҳам эга. Таъсир механизми яллиғланиш, оғриқ ва иситмани патогенезида муҳим роль ўйнайдиган простагландинларнинг ўтмишдоши бўлган арахидон кислотасининг метаболизмидаги асосий фермент – циклооксигеназа (ЦОГ)нинг фаоллигини сусайтириши билан боғлиқ.

Фармакокинетикаси

Вена ичига (в/и) ва мушак ичига (м/и) юборилганида биокираолишлиги 100% ни ташкил этади. М/и ва в/и ичига юборилганидан сўнг тез ва тўлиқ сўрилади. 30 мг дозаси м/и бир марта инъекция қилингандан сўнг C_{max} 50 минутдан кейин эришилади ва 2,2-3,0 мкг/мл ни ташкил этади. 10 мг дозаси в/и инфузия қилинганида плазмада энг юқори миқдори (2,4 мкг/мл) 5,4 минутдан кейин аниқланади. $T_{1/2}$ 4-6 соатни ташкил этади.

Кеторолакни плазма оқсиллари билан боғланиши 99,2%. Боғланиш даражаси қон томирлар ҳавзасидаги концентрацисига боғлиқ эмас. Жигарда метаболизмга учраб, конъюгация бўлган ва гидроксил гуруҳи билан бириккан шакллари ҳосил бўлади. Асосий метаболити гидроксикеторолак фармакологик жиҳатдан фаол эмасдир. Асосан буйраклар орқали чиқарилади. Буйрак функциясини бузилиши бўлган беморларда экскрецияси секинлашади. Экскреция тезлиги буйрак функциясини бузилиш даражасига пропорционал равишда камаяди, оғир даражадаги буйрак етишмовчилиги бўлган беморлар бундан мустасно (буйракларни бундай шикастланиш даражаси учун плазма клиренси кутилгандан анча юқори бўлади). Сийдикда юборилган дозанинг 92%, аҳлатда 6% аниқланади. Кўп марта юборилганида кеторолакнинг клиренси ўзгармайди.

Кеторолак трометаминни мигрен ҳуружларида самара кўрсатганлиги юзасидан маълумотлар бор.

Қўлланилиши

Қуйидаги ҳолатларда ўртача ва кучли оғриқларни бартараф қилиш мақсадида қисқа муддат қўллаш учун кўрсатилган:

– операциядан кейинги оғриқлар: қорин бўшлиғидаги абдоминал, гинекологик, жарроҳлик, ортопедик операциялардан кейин ва хаказо;

– скелет-мушакларини шикастланиши оқибатида ривожланган ўткир оғриқ синдромлари: пайларни ўткир чўзилиши, суякларни чиқиши, синиши ва юмшоқ тўқималарни шикастланиши;
– тиш оғриғи, шу жумладан стоматологик арлашувлардан кейин;
– туғруқдан кейинги оғриқлар (туғруқда кеторолакни қўллаш мумкин эмас);
– онкологик оғриқлар, ишиалгия, фибромиалгия, юмшоқ тўқималарни сурункали патологиясидаги, остеоартроздаги бўғимдан ташқари оғриқ синдромлари каби ҳолатларда оғриқ синдромини зўрайишларида оғриқни қисқа муддатга қолдириш учун ва буйрак ва жигар санчиқларида ёрдамчи восита сифатида қўлланади.

Қўллаш усули ва дозалари
Инъекция кўринишида юборилади. Одатда бошланғич тавсия этилган доза сифатида 10 мг юборилади, м/и 15 мг дан 30 мг гача бўлган дозаларда ҳар 4-6 соатда юбориш мумкин. Вена ичига юборилганида препаратнинг дозаси камида 15 секунд давомида юборилиши керак. Тана вазни 50 кг гача бўлган беморлар ва кекса ёшдаги (65 ёшдан ошган) беморлар учун кичикроқ дозалари қўлланади. Юборишлар ўртасидаги оралиқни қисқартириш (масалан, ҳар 2 соатда) мумкин. Суткалик максимал доза - 90 мг, кекса ва кучсизланган беморларга суткада 60 мг дан кўп эмас. Мажмуавий парентерал ва энтерал юборилганида суткалик доза 120 мг дан ошмаслиги лозим.
Ўткир яққол ифодаланган оғриқни (операциядан кейинги даврда, жароҳат ва куйиш шоки ва бошқалар) даволашда Кеторолакнинг бошланғич 10-30 мг дозаси вена ичига юборилади, сўнгра у 10-15 минутдан кейин такрорланади. Агар зарур бўлса, навбатдаги 10 мг дозаси вена ичига камида 30 минутдан кейин юборилади. Кеторолак билан давомли суткалик даволаш мушак ичига ва вена ичига юборилганида 5 кундан ошмаслиги керак. 5 сутка ўтганидан сўнг пациентни Кеторолакнинг таблетка шаклига ўтказиш мумкин. Кеторолакни вақти-вақти ёки бир марта буюришни узоқ вақт давомида қўллаш мумкин.
Наркотик анальгетиклар оғриқни қолдириш, анксиолитик ва/ёки седатив таъсир кўрсатиши учун параллел равишда қўлланиши мумкин. Кеторолак – периферик анальгетикдир, шунинг учун у нафас фаолиятининг депрессиясини ва наркотикларнинг седатив самарасини кучайтирмайди. Кеторолак наркотик анальгетиклар билан бирга юборилганида, у ҳолда наркотик анальгетикларнинг суткалик дозаси аҳамиятли даражада камайтирилади.
Болалар
Мушак ичига ва вена ичига юбориш учун болаларга тавсия этилган дозаси тана вазнига 0,5 мг/кг ни ташкил этади. Тана вазнига 1,0 мг/кг ҳисобида ҳар 6 соатда оқим билан юбориш ёки соатига 0,17 мг/кг тезлик билан вена ичига инфузия ҳолида юбориш мумкин. Максимал суткалик доза 90 мг ни ташкил этади, максимал даволаш давомийлиги эса 48 соатни ташкил этади. Кеторолакни 1 ёшгача бўлган болаларга қўллаш тавсия этилмайди.

Ножўя таъсирлари
Юрак қон-томир тизими томонидан: кам ҳолларда – брадикардия, артериал босимни ўзгариши, юракни уриб кетиши, хушдан кетиш;
Овқат ҳазм қилиш тизими томонидан: кўнгил айниши, қоринда оғриқ, диарея бўлиши мумкин; кам ҳолларда – қабзият, метеоризм, меъда-ичак йўлларини тўлиш ҳисси, қусиш, оғизни қуриши, чанқоқлик, стоматит, гастрит, меъда-ичак йўлларини эрозив-ярали шикастланишлари, жигар функциясини бузилишлари.
Марказий нерв тизими (МНТ) ва периферик нерв тизими томонидан: безовталик, бош оғриғи, уйқучанлик бўлиши мумкин; кам ҳолларда – парестезиялар, депрессия, эйфория, уйқуни бузилиши, бош айланиши, таъм билиш ҳисларини ўзгариши, кўришни бузилиши, ҳаракат бузилишлари.
Нафас тизими томонидан: кам ҳолларда – нафас фаолиятини бузилиши, бўғилиш ҳуружлари.

Сийдик чиқариш тизими томонидан: кам ҳолларда – сийишни тезлашиши, олигурия, полиурия, протеинурия, гематурия, азотемия, ўткир буйрак етишмовчилиги.
Қон яратиш тизими томонидан: кам ҳолларда – бурундан қон кетиши, анемия, эозонофилия, тромбоцитопения, операциядан кейинги жароҳатлардан қон кетиши.
Моддалар алмашинуви томонидан: тер ажралиши, шишларни ҳосил бўлиши кучайиши мумкин; кам ҳолларда – олигурия, қон плазмасида креатинин ва/ёки мочевинанинг даражасини ошиши, гипокалиемия, гипонатриемия.
Аллергик реакциялар: терини қичишиши, геморрагик тошма бўлиши мумкин; якка ҳолларда – эксфолиатив дерматит, эшакеми, Лайелл синдроми, Стивенс-Джонсон синдроми, анафилактик шок, бронхоспам, Квинке шиши, миалгия бўлиши мумкин.
Бошқалар: иситма бўлиши мумкин.
Маҳаллий реакциялар: инъекция қилинган жойда оғриқ бўлиши мумкин.

Қўллаш мумкин бўлмаган ҳолатлар
Қарши кўрсатмалар
- бронхиал астманинг тўлиқ ёки тўлиқ бўлмаган қўшилиши,бурун ва бурун олди бўшлиқларининг қайталанувчи полипози ва ацетилсалицил кислотаси ёки бошқа НЯҚП ўзлаштираолмаслик (шу жумладан анамнездаги);
- НЯҚП қабул қилиш чақирган эшакэми, ринит (анамнездаги);
- перозалон қатори дори воситаларини ўзлаштираолмаслик;
- дигидратация,гиповолемия (уни чақирган сабабдан қатий назар);
- қон кетишлар ёки уларнинг ривожланишининг юқори хавфи;
- аортакоронар шунтлаш ўтказилганидан кейинги холат;
- тасдиқланган гиперкалиемия;
- ичакнинг ялигланиш касалликлари;
- зўрайиш босқичдаги МИЙ эррозив - ярали шикастланишлари, пептик яралар;
- гипокоагуляция (шу жумладан гемофилия);
- оғир буйрак етишмовчилиги (КК 30мл/мин);
- оғир жигар етишмовчилиги ёки жигарнинг фаол касалликлари;
- геморрогик инсулт (тасдиқланган ёки гумон қилинган);
- геморрогик диатез;
- қон хосил бўлишининг бузилиши;
- хомиладорлик;
- туғруқлар;
- лактация даври (эмизиш) ;
- 16 гача бўлган болалик ёши (самарадорлиги ва хавфсизлиги аниқланмаган);
- кеторолак ва бошқа НЯҚП ларга юқори сезувчанликда қўллаш мумкин эмас.

Дориларнинг ўзаро таъсири
Кеторолак бошқа НЯҚВ билан бир вақтда қўлланганида аддитив ножўя самаралар ривожланиши мумкин; пентоксифиллин, антикоагулянтлар (варфарин, гепарин паст дозаларда) билан – қон кетиш ҳавфи ошиши мумкин; ААФ ингибиторлари билан – буйрак функциясини бузилиш ҳавфи ошиши мумкин; пробенецид билан – плазмада кеторолакнинг концентрацияси ошади ва унинг ярим чиқарилиш даври узаяди; литий препаратлари билан – литийнинг буйрак клиренси пасайиши ва унинг плазмадаги концентрацияси ошиши мумкин; фуросемид билан – сийдик ҳайдовчи таъсири камайиши мумкин. Айрим ўсимлик қўшимчалари билан кеторолакнинг ўзаро тасири мавжуд.Оддий женьщень,гвоздика,занжабил,арника,тансий киз,анжелика динансис ,
чиннигуллар,занжабил,хитой анжеликаси,мойчечак ва гинко билоба қон кетиши хавфини оширади. Кеторолак қўлланганида оғриқни қолдириш мақсадида қўлланадиган опиоид анальгетикларга бўлган талаб камаяди.

Махсус кўрсатмалар
Препарат жигар ва буйрак функциясини бузилишлари, сурункали юрак етишмовчилиги, артериал гиертензияси бўлган пациентларга, анамнезида меъда-ичак йўллари (МИЙ) нинг эрозив-ярали шикастланишлари ва қон кетишлари бўлган беморларга эҳтиётқорлик билан қўлланади. Кеторолак премедикация, тутиб турувчи анестезия ва акушерлик амалиётида оғриқ қолдириш учун восита сифатида қўллаш тавсия этилмайди.
Операциядан кейинги даврда, айниқса синчков гемостаз талаб этиладиган ҳолатларда (шу жумладан, простата безини резекциясидан кейин, тонзиллоэктомиядан кейин, косметик жарроҳликда), шунингдек кекса ёшдаги беморларда кеторолакни эҳтиётқорлик билан қўллаш керак, чунки кеторолакнинг ярим чиқарилиш даври узаяди, плазма клиренси эса пасайиши мумкин. Ушбу тоифадаги беморларда кеторолакни терапевтик диапазоннинг пастки чегарасига яқин дозаларда қўллаш тавсия этилади. Жигарни шикастланиш симптомлари, тери тошмаси, эознофилия пайдо бўлганида кеторолакни бекор қилиш керак.
Ҳомиладорлик ва лактация даврида қўлланилиши
Ҳомиладорлик ва лактация даврида қўллаш мумкин эмас.
Автомобиль ва мураккаб механизмларни бошқариш қобилиятига таъсири
Агар кеторолак билан даволаниш вақтида уйқучанлик, бош айланиши, уйқусизлик ёки депрессия пайдо бўлса, диққатни жамлаш ҳамда психомотор реакциялар тезлигини талаб этувчи потенциал ҳавфли фаолият турларини бажариш вақтида эҳтиётқорликка риоя қилиш керак.

Дозани ошириб юборилиши
Симптомлари (бир марта юборилганида): қоринда оғриқ, кўнгил айниши, қусиш, гипервентиляция, пептик яралар ва/ёки эрозив гастритни ривожланиши, буйрак функциясини бузилиши бўлиши мумкин.

Чиқарилиш шакли
1 мл дан тўқ рангли шиша ампулаларда. 5 ёки 10 ампула тиббиётда қўлланилишига доир йўриқномаси билан бирга картон қутига жойланган.

Сақлаш шароити
Қуруқ, қоронғи жойда, 15-25°С ҳароратда сақлансин.
Болалар оломайдиган жойда сақлансин.

Яроқлилик муддати
3 йил. Яроқлилик муддати тугаганидан сўнг қўлланилмасин.

Дорихоналардан бериш тартиби
Рецепт бўйича.

Ишлаб чиқарувчи
“Adore Pharmaceuticals Pvt. Ltd.”, **Ҳиндистон**

“Avison Pharmaceuticals Pvt. Ltd.”, **Ҳиндистон учун ишлаб чиқарилган**

Ўзбекистон Республикаси ҳудудида дори воситаларининг сифати бўйича эътирозлар (таклифлар) ни қабул қилувчи ташкилот номи ва манзили
“Shayana Farma” МЧЖ
Тошкент ш., Уста Ширин кўч., 117 уй
Тел.: +99871 228-16-92