

Қазақстан Республикасы
Денсаулық сақтау министрлігі
медициналық және
фармацевтикалық қызметті
бақылау комитеті Төрағасының
20 ____ жылғы “ ____ ” _____
№ ____ бұйрығымен
БЕКІТІЛГЕН

**Дәрілік заттың медицинада қолданылуы
жөніндегі нұсқаулық**

Доломин[®]

Саудалық атауы
Доломин[®]

Халықаралық патенттелмеген атауы
Кеторолак

Дәрілік түрі
Бұлшықет ішіне енгізуге арналған ерітінді 30 мг/мл

Құрамы
Бір ампуланың (1 мл) ішінде
белсенді зат - кеторолак трометамолы 30 мг,
қосымша заттар: этанол (95 % этил спирті 100 % затқа шаққанда), натрий
хлориді, натрий гидроксидінің 1 М ерітіндісі немесе 1 М хлорсутек
қышқылы, инъекцияға арналған су

Сипаттамасы
Ашық-сары түсті мөлдір сұйықтық

Фармакотерапиялық тобы
Қабынуға қарсы және ревматизмге қарсы препараттар. Қабынуға қарсы
стероидты емес препараттар. Сірке қышқылының туындылары.
Кеторолак
АТХ коды M01AB15

Фармакологиялық қасиеттері

Фармакокинетикасы

Бұлшықет ішіне 30 мг енгізгеннен кейінгі ең жоғарғы концентрациясы
(C_{max}) – 1,74-3,1 мкг/мл, 60 мг – 3,23-5,77 мкг/мл. Ең жоғарғы
концентрациясына жету уақыты (TC_{max}) – 15-70 мин. Плазма
акуыздарымен байланысуы – 99 %. Парентеральді енгізгенде тепе-теңдік
концентрациясына жету уақыты (C_{ss}) – тәулігіне 4 рет тағайындағанда

(субтерапевтіктен жоғары) 24 сағатты және 15 мг бұлшықет ішіне енгізгенде – 0,5-1 мкг/мл, 30 мг – 1-2,5 мкг/мл құрайды. Таралу көлемі – 0,15-0,3 л/кг. Емшек сүтіне өтеді. Енгізілген дозасының 50 %-дан астамы фармакологиялық белсенді емес метаболиттері түзе отырып, бауырда метаболизденеді. Негізгі метаболиттері бүйрекпен шығарылатын глюкуронидтер және р-гидроксикеторолак болып табылады. 90 %-ы бүйрекпен, 6 %-ы – ішек арқылы шығарылады. Бүйрек функциясы қалыпты емделушілердегі жартылай шығарылу кезеңі ($T_{1/2}$) – орташа алғанда 5,3 сағат (30 мг бұлшықет ішіне енгізгеннен кейін 3,5-9,2 сағат). $T_{1/2}$ егде жастағы емделушілерде артады және жастарда қысқарады. Бауыр функциясы $T_{1/2}$ -ге әсер етпейді. Бүйрек функциясы бұзылған емделушілерде плазмадағы креатинин концентрациясы 19-50 мг/л (168 - 442 мкмоль/л) кезінде $T_{1/2}$ – 10,3-10,8 сағат, бүйрек жеткіліксіздігі айқынырақ болса –13,6 сағаттан асады. Жалпы клиренсі 30 мг бұлшықет ішіне енгізгенде – 0,023 л/сағ/кг (егде жастағы емделушілерде 0,019 л/сағ/кг); бүйрек жеткіліксіздігі бар емделушілерде 30 мг бұлшықет ішіне енгізгенде плазмадағы креатинин концентрациясы 19-50 мг/л кезінде – 0,015 л/сағ/кг. Гемодиализ арқылы шығарылмайды.

Фармакодинамикасы

Қабынуға қарсы стероидты емес препарат (ҚҚСП). Айқын ауыруды басатын әсер береді, сондай-ақ қабынуға қарсы және ыстықты түсіретін орташа әсерлері бар. Әсер ету механизмі арахидон қышқылынан простагландиндердің түзілуін катализдейтін циклооксигеназа-1 мен циклооксигеназа-2 белсенділігін селективті емес бәсеңдетуімен байланысты, ол ауыру, қабыну және қызба патогенезінде маңызды рөл атқарады.

Бұлшықет ішіне енгізгеннен кейін ауыруды басатын әсері 0,5 сағаттан соң білінеді, ең жоғарғы әсеріне 1-2 сағаттан соң жетеді.

Қолданылуы

Айқындығы күшті және орташа ауыру синдромында

- жарақаттарда, шығып кетулерде, созылуларда
- тіс ауыруында
- операциядан кейінгі кезеңдегі ауыруларда
- онкологиялық ауруларда
- миалгияларда, артралгияларда, невралгияларда, радикулитте, ревматизм ауруларында

Қолдану тәсілі мен дозалары

Бұлшықет ішіне (б/і).

18 жастан 64 жасқа дейінгі, дене салмағы 50 кг асатын емделушілерге, б/і бір енгізгенде 60 мг (ішілетін дозасын қоса) асырмай, әдетте әр 6 сағат сайын 30 мг енгізеді.

Дене салмағы 50 кг аз немесе созылмалы бүйрек жеткіліксіздігі бар (СБЖ) ересек емделушілерге 1 б/і енгізгенде 30 мг (ішілетін дозасын қоса)

асырмай енгізеді.

18 жастан 64 жасқа дейінгі, дене салмағы 50 кг асатын емделушілер үшін б/і енгізуге арналған ең жоғарғы тәуліктік дозасы тәулігіне 90 мг құрайды; дене салмағы 50 кг аз немесе СБЖ бар ересек емделушілерге, сондай-ақ егде жастағы емделушілерге (65 жастан асқан) – тәулігіне 60 мг. Емдеу ұзақтығы 5 тәуліктен аспауы тиіс.

Жағымсыз әсерлері

Жиі –3 %-дан артық, жиі емес – 1-3 %, сирек –1 %-дан аз

Жиі

- гастралгиялар, диарея
- бас ауыруы, бас айналуы, ұйқышылдық
- ісінулер (беттің, балтырдың, тобықтардың, саусақтардың, табандардың ісінуі, дене салмағының артуы)

Жиі емес

- стоматит
- құсу, асқазанның толып кету сезімі, метеоризм, іш қатуы
- артериялық қысымның жоғарылауы
- енгізген жердің шымылдатуы немесе ауыруы
- қатта терлеу
- тері бөртпесі (макулопапуллездік бөртпені қоса), пурпура

Сирек

- жүрек айнуы, асқазан-ішек жолының эрозиялы-ойық жаралы зақымданулары (соның ішінде тесілумен және/немесе қан кетумен – абдоминальді ауыру, эпигастрий аймағының түйілуі немесе шымылдатуы, қан аралас нәжіс немесе мелена, қан аралас немесе «кофе қоюы» типті құсу, қыжыл және т.б.)
- холестаздық сарғаю, гепатомегалия, гепатит, жедел панкреатит
- белдің ауыруы гематуриямен және/немесе азотемиямен немесе гематуриясыз және/немесе азотемиясыз, жиі несеп шығару, несеп мөлшерінің артуы немесе азаюы, шығу тегі бүйректік ісінулер
- нефрит, жедел бүйрек жеткіліксіздігі, гемолитикалық-уремиялық синдром (гемолитикалық анемия, бүйрек жеткіліксіздігі, тромбоцитопения, пурпура)
- естудің нашарлауы, құлақтағы шуыл, көрудің нашарлауы (оның ішінде көру жітілігінің анық болмауы)
- бронх түйілуі немесе диспноэ, ринит, өкпенің ісінуі, көмейдің ісінуі (ентігу, тыныстың тарылуы)
- асептикалық менингит (қызба, қатты бас ауыруы, құрысулар, мойын және/немесе арқа бұлшықеттерінің сіресуі), аса жоғары белсенділік (көңіл-күй өзгерістері, мазасыздық), елестеулер, депрессия, психоз
- естен тану
- анемия, эозинофилия, лейкопения

- операциядан кейінгі жарадан қан кетуі, мұрыннан қан кету, ректальді қан кету
- эксфолиативтік дерматит (қалтыраумен немесе онсыз жүретін қызба, терінің қызаруы, тызыдануы немесе түлеуі, таңдай бадамша бездерінің домбығуы және/немесе ауыруы), есекжем, Стивенс-Джонсон синдромы, Лайелл синдромы
- анафилаксия немесе анафилактоидтық реакциялар (бет терісі түсінің өзгеруі, тері бөртпесі, есекжем, терінің қышуы, тахипноэ немесе диспноэ, қабақтардың ісінуі, қабақ маңының ісінуі, еңтігу, тыныстың тарылуы, кеуде қуысындағы ауырлық сезімі, сырылдап дем алу)
- тілдің ісінуі, қызба

Қолдануға болмайтын жағдайлар

- кеторолакқа, басқа қабынуға қарсы стероидты емес препараттарға немесе қосымша заттарының біріне аса жоғары сезімталдық
- "аспириндік" триада (бронх демікпесінің, қайталанған мұрын мен мұрын маңы қойнаулары полипозының және ацетилсалицил қышқылы мен пиразолон қатарының дәрілік заттарын көтере алмаушылықтың бірігіп келуі)
- гиповолемия (туындау себебіне байланыссыз)
- асқазан-ішек жолының өршу сатысындағы эрозиялы-ойық жаралы зақымдалулары
- гипокоагуляция (соның ішінде, гемофилия), қан кетулер немесе олардың даму қаупінің жоғарылығы
- бүйректің ауыр жеткіліксіздігі (плазма креатинині 50 мг/л жоғары)
- бауырдың ауыр жеткіліксіздігі
- жүктілік және лактация кезеңі (болымсыз мөлшерде емшек сүтіне енеді)
- балаларға (18 жасқа дейін – қауіпсіздігі мен тиімділігі анықталмаған).

Сақтықпен

Бронх демікпесі, асқазан-ішек жолына қатысты уыттылықты арттыратын факторлардың болуы: маскүнемдік, темекі шегу, холецистит; созылмалы жүрек жеткіліксіздігі, ісіну синдромы, артериялық гипертензия, бүйрек функциясының бұзылуы (плазма креатинині 50 мг/л төмен), холестаз, белсенді гепатит, сепсис, жүйелі қызыл жегі, басқа ҚҚСП-мен бір мезгілде қабылдау немесе егде жастағылар (65 жастан асқан).

Дәрілермен өзара әрекеттесуі

Парацетамолмен бірге тағайындау кеторолактың нефроуыттылығын арттырады.

Басқа ҚҚСП-мен, глюкокортикостероидтармен, этанолмен, кортикотропинмен, кальций препараттарымен қабылдау асқазан-ішек жолының шырышты қабығының ойық жаралану және асқазан-ішектен қан кетулердің даму қаупін арттырады.

Антикоагулянттармен – кумарин және индандион туындыларымен, гепаринмен, тромболитиктермен (алтеплаза, стрептокиназа, урокиназа), антиагреганттармен, цефалоспориндермен, вальпрой қышқылымен және ацетилсалицил қышқылымен бір мезгілде тағайындау қан кетулердің даму қаупін арттырады.

Гипотензиялық және диуретиктік дәрілік заттардың әсерін төмендетеді (бүйректегі простагландиндердің синтезін төмендетеді).

Метотрексатпен бірге тағайындау гепато- және нефроуыттылығын арттырады (оларды тек соңғысының төменгі дозаларын пайдаланғанда және оның плазмадағы концентрациясын бақылай отырып қана бірге тағайындауға болады).

Пробенецид кеторолактың плазмалық клиренсі мен таралу көлемін азайтады, оның қан плазмасындағы концентрациясын жоғарылатады және оның жартылай шығарылу кезеңін арттырады. Кеторолакты қолдану аясында метотрексат пен литий клиренсі азаюы және бұл заттардың уыттылығы күшеюі мүмкін. Тікелей емес антикоагулянттармен гепаринмен, тромболитиктермен, антиагреганттармен, цефоперазонмен, цефотетанмен және пентоксифиллинмен бір мезгілде тағайындау қан кету қаупін арттырады.

Басқа нефроуытты дәрілік заттармен тағайындағанда (оның ішінде, алтын препараттарымен) нефроуыттылығының даму қаупі артады.

Өзекшелік секрецияны бөгейтін дәрілік заттар, кеторолак клиренсін төмендетеді және оның плазмадағы концентрациясын арттырады.

Есірткілік анальгетиктердің әсерін арттырады.

Миелоуытты дәрілік заттар препараттың гематоуыттылығының білінуін күшейтеді.

Кеторолакты психотроптық препараттармен (флуоксетин, тиотиксен, алпразолам) бірге қабылдағанда емделушілерде елестеулер байқалған.

Айрықша нұсқаулар

Препаратты тағайындар алдында препаратқа немесе ҚҚСП-ға алдыңғы аллергия туралы мәселені анықтап алу қажет. Аллергиялық реакциялардың даму қаупіне баланысты, бірінші дозасын енгізуді дәрігердің мұқият бақылауымен жүргізеді.

Препараттың 1 мл ерітіндісі құрамында 100 мг этил спирті бар, сондықтан маскүнемдіктен зардап шегетін адамдарға, бауыр аурулары және эпилепсиясы бар емделушілерге қауіпті болуы мүмкін.

Гиповолемия нефроуытты жағымсыз реакцияларының даму қаупін арттырады. Қажет болса, есірткілік анальгетиктермен біріктіріп тағайындауға болады. Премедикацияға, анестезияны ұстап тұруға арналған дәрілік зат ретінде қолдану ұсынылмайды.

Басқа ҚҚСП-мен бірге қабылдағанда, сұйықтық іркілуі, жүрек қызметінің декомпенсациясы, артериялық қысымның жоғарылауы байқалуы мүмкін. Тромбоциттер агрегациясына ықпалы 24-48 сағаттан соң тоқтайды. Парацетамолмен 5 тәуліктен артық пайдалануға болмайды.

Қан ұйығыштығының бұзылуы бар науқастарға тек тромбоциттер санын тұрақты бақылай отырып тағайындайды, әсіресе, мұқият гемостаз бақылауын қажет ететін операциядан кейінгі науқастар үшін маңызды.

Дәрілік асқынулардың даму қаупі емдеуді ұзартқанда (созылмалы ауырулары бар науқастар) және препарат дозасын тәулігіне 40 мг арттырғанда артады.

Дәрілік заттың көлік құралын немесе қауіптілігі зор механизмдерді басқару қабілетіне әсер ету ерекшеліктері.

Кеторолакты қолданған кезде ұйқышылдық және бас айналуының пайда болуы мүмкіндігіне байланысты, автокөлік жүргізгенде және жоғары зейін шоғырландыру мен психомоторлық реакциялардың жылдамдығын қажет ететін басқа қауіптілігі зор қызмет түрлерімен шұғылданғанда сақ болу қажет.

Артық дозалануы

Симптомдары (бір рет енгізгенде) – іштің ауыруы, жүрек айнуы, құсу, асқазан-ішек жолының эрозиялы-ойық жаралы зақымдануы, бүйрек функциясының бұзылуы, метаболикалық ацидоз.

Емі – симптоматикалық (организмнің өмірлік маңызды қызметтерін ұстап тұру). Диализдің тиімділігі аз.

Шығарылу түрі мен қаптамасы

Бұлшықет ішіне енгізуге арналған ерітінді 30 мг/мл.

1 мл-ден түрлі-түсті сындыру сақинасы немесе түрлі-түсті нүктесі мен кертiгi бар жарықтан қорғайтын шыны ампулаларда.

Ампулаларға қосымша бiр, екi немесе үш түрлі-түсті сақина және/немесе екiөлшемдi штрих-код, және/немесе әрiп-сандық кодировка немесе қосымша түрлі-түсті сақинасыз, екiөлшемдi штрих-кодсыз, әрiп-сандық кодировкасыз салынады.

5 ампуладан поливинилхлоридтi үлбiр мен алюминий фольгадан немесе полимер үлбiрден немесе фольгасыз және үлбiрcіз пiшiндi ұяшықты қаптамаға салады.

1 немесе 2 пiшiндi ұяшықты қаптамадан медицинада қолданылуы жөнiндегi мемлекеттiк және орыс тiлдерiндегi нұсқаулықпен бiрге картоннан жасалған пәшкеде.

Сақтау шарттары

Жарықтан қорғалған жерде, 15-тен 25 °С-ге дейiнгi температурада сақтау керек. Балалардың қолы жетпейтiн жерде сақтау керек!

Сақтау мерзiмi

4 жыл

Қаптамасында көрсетiлген жарамдылық мерзiмi өткеннен кейiн пайдалануға болмайды.

Дәріханалардан босатылу шарттары
Рецепт арқылы

Өндіруші

«ФармФирма «Сотекс» жабық акционерлік қоғамы, Ресей
141345, Мәскеу обл., Сергиев-Посад муниципалдық ауданы,
Березняков елді мекені, Беликово кенті, 11 үй
Тел./факс: (495) 956-29-30.

Тіркеу куәлігі иесінің атауы мен елі

«ФармФирма «Сотекс» жабық акционерлік қоғамы, Ресей

***Қазақстан Республикасы аумағында тұтынушылардан өнім (тауар)
сапасына қатысты шағымдарды қабылдайтын ұйымның мекенжайы***
«ЕL company (ЕЛ компани)» ЖШС, Қазақстан Республикасы,
Алматы қ., Масаншы к-сі, 98А, 41 кеңсе
Телефон: (727) 292-26-30, факс: 292-26-37.