تيكاغول

مضغوطات مليسة بالفيلم ٦٠ ملغ / ٩٠ ملغ

التركيب :
يحوي كل قرص مليس بالفيلم: تيكاغريلور ٦٠ ملغ أو ٩٠ ملغ.
السواغات:
النواة: مانيتول، فوسفات هيدروجين كالسيوم دي هيدرات، ستيرات المغنيزيوم، صوديوم نشاء غليكولات، هيدروكسي بروبيل سيللوز
الفيلم: ثاني أوكسيد التيتانيوم، ماكروغول٤٠٠، هيدروكسي بروبيل ميثيل سيللوز، أوكسيد الحديد الأحمر.

التحذيرات:
خطر النزف:
- إن تيكاغريلور – مثل باقي الأدوية المضادة للصفيحات - يمكن أن يسبب نزفا ذي أهمية وقد يكون مميتاً أحياناً.
- لا يستخدم تيكاغريلور عند المرضى الذين يعانون من نزف مرضي فعال أو لديهم قصة مرضية سابقة للإصابة بنزف داخل القحف.
- لا يبدأ باستخدام تيكاغريلور عند المرضى المخطط لهم الخضوع لجراحة طعم مجازة الشريان التاجي الإسعافية. عند الإمكان، يجب التوقف عن تناول تيكاغريلور مدة ٥ أيام على الأقل قبل أي عملية.
- يجب أن يُشك بوجود نزف عند أي مريض لديه انخفاض في الضغط وخضع مؤخراً لعملية تصوير الأوعية التاجية ، عملية رأب الوعاء التاجي عبر اللمعة من خلال الجلد ، عملية طعم مجازة الشريان التاجي أو أي إجراءات جراحية أخرى عند استخدام تيكاغريلور.
- في حال إمكانية ذلك، يتم تدبير النزف دون إيقاف العلاج بـ تيكاغريلور. يزيد إيقاف تيكاغريلور من خطر الاضطرابات القلبية الوعائية اللاحقة.
- لا يوقف استخدام تيكاغريلور بدون مراجعة الطبيب.

جرعة الأسبرين وفعالية التيكاغريلور:
- تخفض جرعات الصيانة فوق ال ١٠٠ ملغ من الأسبيرين من فعالية تيكاغريلور ويجب أن يتم تجنبها. بعد أي جرعة بدئية يستخدم الأسبيرين بجرعات ٧٥-١٠٠ ملغ / باليوم.

الخصائص الفارماكولوجية:
آلية التأثير :
يتفاعل التيكاغريلور ومستقلباته الرئيسية بشكل عكوس مع مستقبل الصفيحات P2Y12 ADP ليمنع نقل الإشارة وتفعيل الصفيحات. إن التيكاغريلور ومستقلباته الفعالة متساوية تقريباً في الفعالية.
الديناميكية الدوائية:
يتم الوصول إلى القيمة العظمى لتأثير الـ IPA (تثبيط تكدس الصفيحات) لتيكاغريلور بعد حوالي ٢ ساعة من الإعطاء وتستمر الفعالية حتى ٨ ساعات على الأقل.
الحرائك الدوائية:
الامتصاص:
إن متوسط التوافر الحيوي المطلق لتيكاغريلور هو حوالي ٣٦% (المجال ٣٠% -٤٢%). إن تناول وجبة عالية الدسم ليس له تأثير على التركيز الأعظمي للتيكاغريلور ولكنه يسبب زيادة في المساحة تحت المنحني AUC بنسبة ٢١%. ينخفض التركيز الأعظمي لمستقلبه الرئيسي بنسبة ٢٢% مع عدم حدوث تغير في AUC. يمكن تناول تيكاغريلور مع أو بدون طعام.
التوزع:
إن حجم التوزع للتيكاغريلور في حالة الثبات هو ٨٨ لتر. يرتبط تيكاغريلور ومستقلبه الفعال بشدة ببروتينات البلازما عند الإنسان(أكثر من ٩٩%).
الاستقلاب:
CYP3A4 هو الإنزيم الأساسي المسؤول عن استقلاب تيكاغريلور وتكوين مستقلبه الرئيسي الفعال. إن تيكاغريلور ومستقلبه الرئيسي الفعال هما ركائز ومثبطات ضعيفة للناقل P-غليكوبروتين. إن نسبة التعرض الجهازي للمستقلب الفعال هي حوالي ٣٠-٤٠% من التعرض لتيكاغريلور.
الإطراح:
الطريق الرئيسي لإطراح التيكاغريلور هو الاستقلاب الكبدي.
الطريق الرئيسي لإطراح المستقلب الرئيسي لتيكاغريلور هو -على الأغلب- الإفراز الصفراوي. متوسط العمر النصفي هو حوالي ٧ ساعات للتيكاغريلور و٩ ساعات للمستقلب الفعال.
الاستطبابات:
المتلازمات الإكليلية الحادة:
التيكاغريلور هو مثبط للصفيحات P2Y12 يستطب لتخفيض معدل الحوادث القلبية الوعائية الخثارية عند المرضى الذين يعانون من المتلازمة الإكليلية الحادة (الذبحة غير المستقرة، احتشاء عضلة القلب غير المترافق بارتفاع الشدفة ST او احتشاء عضلة القلب المترافق بارتفاع الشدفة ST. وجد أن تيكاغريلور يخفض من معدل نقطة النهاية المشتركة للموت القلبي الوعائي، احتشاء العضلة القلبية أو السكتة مقارنة مع الكلوبيدوغريل. كما أنه خفض من معدل الخثار الناتج عن الشبكة عند المرضى الذين تتم معالجتهم بعملية رأب الوعاء عبر اللمعة من خلال الجلد.
تم دراسة تيكاغريلور في المتلازمات الإكليلية الحادة بالترافق مع الأسبيرين. تخفض جرعات الصيانة من الأسبيرين فوق ال ١٠٠ ملغ من فعالية تيكاغريلور. يجب تجنب جرعات الصيانة من الأسبيرين فوق الـ ١٠٠ ملغ يومياً.
مضادات الاستطباب:
قصة مرضية سابقة لوجود نزف داخل القحف:
إن تيكاغريلور مضاد استطباب عند المرضى الذين لديهم قصة مرضية سابقة للإصابة بنزف داخل القحف بسبب الخطر العالي لانتكاس هذه الحالة عند هؤلاء المرضى.
النزف الفعال:
إن تيكاغريلور مضاد استطباب عند المرضى الذين يعانون من نزف مرضي فعال كالقرحة الهضمية أو النزف داخل القحف.
الاعتلال الكبدي الشديد:
إن تيكاغريلور مضاد استطباب عند المرضى الذين يعانون من اعتلال كبدي شديد بسبب الزيادة المحتملة للتعرض لهذا الدواء، كما أن هذا الدواء لم تتم دراسته عند هؤلاء المرضى. يزيد الاعتلال الكبدي الشديد من خطر النزف بسبب التصنيع المنخفض لبروتينات التخثر.
فرط الحساسية:
إن تيكاغريلور مضاد استطباب عند المرضى الذين لديهم فرط حساسية (مثل الوذمة الوعائية) لـ التيكاغريلور أو أي من مكونات هذا المستحضر.
التأثيرات الجانبية:
- النزف:

نزف كبير – مميت/ مهدد للحياة: أي مما يلي: النزف المميت داخل القحف أو داخل التأمور مع دكاك قلبي، صدمة نقص الحجم أو انخفاض ضغط شديد بسبب النزف و الذي يحتاج لرافعات ضغط أو جراحة، وجود نزف واضح أو ظاهر سريرياً مترافق مع انخفاض في الهيموغلوبين بأكثر من ٥ غ/دسل، نقل ٤ وحدات دموية أو أكثر(دم كامل أو كريات حمراء فقط) للنزف.

نزف كبير – أخرى: أي مما يلي: معطل للحياة بشكل مهم (كالنزف في باطن العين مع فقدان دائم للبصر)، وجود نزف واضح أو ظاهر سريرياً مترافق مع انخفاض في الهيموغلوبين حوالي ٣ غ/دسل، نقل ٢-٣ وحدات دموية (دم كامل أو كريات حمراء فقط) للنزف.

نزف صغير: يتطلب تدخل طبي لإيقافه أو علاجه (رعاف يتطلب زيارة مركز طبي للعلاج).

نزف بسيط: كل النزوف الأخرى (كالكدمات، نزوف اللثة، النز من أماكن الحقن .. الخ) ، لا تتطلب التدخل أو العلاج.

- التأثيرات الجانبية غير المرتبطة بالنزف:

زلة تنفسية، صداع، سعال، دوخة، عثيان، رجفان أذيني، ارتفاع ضغط، ألم صدري غير قلبي، إسهال، ألم في الظهر، انخفاض ضغط، تعب، ألم صدري، تباطؤ قلب، تدني الذكور.

- التغيرات في قيم الفحوص المخبرية:

ارتفاع في قيم حمض البول المصلية، زيادة في مستويات الكرياتينين المصلية.

التحذيرات والاحتياطات:
المخاطر العامة للنزف:
تزيد الأدوية التي تثبط فعالية الصفيحات -بما فيها تيكاغريلور- من خطر النزف. يزيد تيكاغريلور من الخطر العام لحدوث نزوف (كبيرة + صغيرة) بدرجة أكبر من الكلوبيدوغريل. لوحظت هذه الزيادة في النزوف غير المرتبطة بعملية طعم مجازة الشريان التاجي بينما لم تلاحظ في النزوف المرتبطة بهذه العملية. لم تزدد معدلات النزوف المميتة أو المهددة للحياة.
بشكل عام، تتضمن عوامل الخطر للنزف التقدم في العمر، قصة مرضية سابقة لاضطرابات نزفية، إجراء عمليات جائرة تحت الجلد، و الاستخدام المتزامن لأدوية تزيد من خطر النزف (مثل مضادات التخثر ،العلاج بحالات الخثرة، جرعات عالية من الأسبيرين و تناول مضادات الالتهاب غير الستيرونيدية بشكل مزمن).
عند الإمكان، يجب إيقاف تيكاغريلور لخمسة أيام قبل العمل الجراحي. كما يجب الشك بوجود نزف عند أي مريض لديه انخفاض في الضغط وخضع مؤخراً لعملية تصوير الأوعية التاجية،عملية رأب الوعاء عبر اللمعة من خلال الجلد ،عملية طعم مجازة الشريان التاجي أو أي عمليات جراحية أخرى. حتى وإن كان المريض لا يظهر أية علامات على النزف.
إن كان من الممكن، يتم تدبير النزف دون إيقاف تيكاغريلور. يزيد إيقاف تيكاغريلور من خطر الحوادث القلبية الوعائية اللاحقة.
الاستخدام المتزامن لجرعات الصيانة من الأسبيرين:
يخفض استخدام تيكاغريلور مع جرعات الصيانة من الأسبيرين فوق ال ١٠٠ ملغ من فعالية تيكاغريلور. لذلك، بعد جرعة التحميل البدئية من الأسبيرين (عادة ٣٢٥ ملغ)، يستخدم تيكاغريلور مع جرعة صيانة من الأسبيرين ٧٥-١٠٠ ملغ.

الاعتلال الكبدي متوسط الشدة:
لم تتم دراسة تيكاغريلور عند مرضى الاعتلال الكبدي متوسط الشدة. يتم الأخذ بعين الاعتبار مخاطر وفوائد المعالجة مع ملاحظة الزيادة المحتملة في التعرض للتيكاغريلور.
الزلة التنفسية:
سجلت الزلة التنفسية عند ١٤% من المرضى الذين تم علاجهم بـ تيكاغريلور و عند ٨% من المرضى الذين يتناولون كلوبيدوغريل. كانت الزلة التنفسية عادة خفيفة إلى متوسطة الشدة و غالباً ما زالت مع استمرار المعالجة، لكن كان إيقاف المعالجة ضرورياً أحياناً (عند ٠,٩% من المرضى الذين يتناولون تيكاغريلور مقابل ٠,١% من المرضى الذين يتناولون كلوبيدوغريل). إن تطور عند المريض زلة تنفسية جديدة أو تطاول زمن الزلة التنفسية التي يعاني منها أو ساءت خلال المعالجة بـ تيكاغريلور فيجب نفي وجود أمراض أخرى كامنة قد تتطلب العلاج. إذا تم تحديد أن الزلة مرتبطة باستخدام تيكاغريلور،فليس هناك علاج نوعي مطلوب إنما يمكن الاستمرار بالمعالجة بـ تيكاغريلور دون توقف. في حالة الزلة التنفسية غير المحتملة التي تتطلب إيقاف تيكاغريلور فينصح بوصف مضادات صفيحات أخرى.
إيقاف المعالجة بـ تيكاغريلور:
يجب تجنب إيقاف تيكاغريلور بشكل مفاجئ. فإن كان لابد من إيقاف العلاج بشكل مؤقت (على سبيل المثال: لعلاج نزف أو لإجراء جراحة اختيارية)، فيجب إعادة البدء باستخدامه بأقصى سرعة ممكنة. سيزيد إيقاف المعالجة بـ تيكاغريلور من خطر حدوث احتشاء عضلة قلبية، خثار في الشبكة و الموت.
المثبطات القوية للسيتوكروم CYP3A:
يستقلب التيكاغريلور بواسطة CYP3A4/5. يجب تجنب استخدامه مع المثبطات القوية للـ CYP3A مثل: أتازانافير ، كلاريثرومايسين، إيندينافير، إيتراكونازول، كيتوكونازول، نيفازودون، نيلفينافير، ريتونافير، ساكوينافير، تيليثرومايسين و فوريكونازول.
المحرضات القوية للسيتوكروم CYP3A:
يجب تجنب استخدامه مع المحرضات القوية لـ CYP3A مثل: ريفامبين، ديكساميتازون، فينيتوئين، كاربامازبين و فينوباربيتال.
التداخلات الدوائية:
- تأثيرات الأدوية الأخرى:

يستقلب التيكاغريلور بشكل أساسي بواسطة CYP3A4 وبدرجة أقل بواسطة CYP3A5. التيكاغريلور هو أيضاً ركازة لـ P- غليكوبروتين.
مثبطات ال CYP3A القوية:
يجب تجنب استخدامه مع المثبطات القوية لـ CYP3A (مثل: كيتوكونازول، إيتراكونازول، فوريكونازول، كلاريثرومايسين، نيفازودون، ريتونافير، ساكوينافير، نيلفينافير، إيندينافير، أتازانافير و تيليثرومايسين).
المحرضات القوية ل CYP3A:
يجب تجنب استخدامه مع المحرضات القوية لـ CYP3A (مثل: ريفامبين، ديكساميتازون، فينيتوئين، كاربامازبين و فينوباربيتال).
أسبيرين:
استخدام تيكاغريلور مع جرعات الصيانة من الأسبيرين فوق الـ ١٠٠ ملغ يخفض من فعالية تيكاغريلور.
- تأثيرات تيكاغريلور على الأدوية الأخرى:

تيكاغريلور هو مثبط للـ CYP3A4/5 وناقل P- غليكوبروتين.
سيمفاستاتين، لوفاستاتين
يسبب تيكاغريلور ارتفاع تراكيز السيمفاستاتين واللوفاستاتين المصلية لأن هذه الأدوية تستقلب بواسطة CYP3A4. تجنب جرعات من السيمفاستاتين و اللوفاستاتين الأكبر من ٤٠ ملغ.
ديجوكسين:
بسبب تثبيط ناقل الـ P- غليكوبروتين، يجب مراقبة مستويات الديجوكسين عند البدء بـ أو عند إجراء أي تغيير على المعالجة بـ تيكاغريلور.
- المعالجات المتزامنة الأخرى:

يمكن إعطاء تيكاغريلور مع الهيبارين غير المجزأ أو منخفض الوزن الجزيئي، مثبطات GPIIb/IIIa، مثبطات مضخة البروتون، حاجبات بيتا، مثبطات الخميرة المحولة للأنجيوتنسين، وحاجبات مستقبلات الأنجيوتنسين.
الحمل والإرضاع:
الحمل: التصنيف C:
لا توجد دراسات مناسبة و جيدة الضبط على استخدام تيكاغريلور عند النساء الحوامل. في الدراسات على الحيوانات، سبب استخدام تيكاغريلور تشوهات بنيوية عند جرعات الأم ٥ إلى ٧ مرات الجرعة العظمى الموصى بها عند الإنسان بناء على مساحة سطح الجسم. يجب أن يكون استخدام تيكاغريلور خلال الحمل مقتصراً على الحالات التي تكون فيها فوائده المحتملة تبرر مخاطره المحتملة على الجنين.
الإرضاع:
ليس من المعروف إن كان التيكاغريلور أو مستقلباته الفعالة تطرح في حليب الإنسان. يطرح التيكاغريلور في حليب الجرذان. بما أن العديد من الأدوية تطرح في حليب الإنسان وبسبب احتمال حدوث تأثيرات جانبية خطيرة عند الرضع ناتجة عن تيكاغريلور فيجب اتخاذ قرار إما بإيقاف الإرضاع أو إيقاف الدواء، مع الأخذ بالحسبان أهمية الدواء للأم.
الاستخدام عند الأطفال:
لم تتم دراسة أمان وفعالية تيكاغريلور عند المرضى الأطفال.
الاستخدام عند كبار السن:
إن الخطر النسبي للنزف متماثل عند المرضى فوق ال ٦٥ عاماً والأشخاص بعمر أكبر من الـ ٧٥ عام. إلا أنه لا يمكن استبعاد وجود حساسية مفرطة عند بعض كبار السن.
الاعتلال الكبدي:
لم تتم دراسة تيكاغريلور عند مرضى الاعتلال الكبدي الشديد إلى متوسط الشدة.
يستقلب تيكاغريلور عن طريق الكبد وقد يزيد اعتلال الوظيفة الكبدية من مخاطر النزف والتأثيرات الجانبية الأخرى. لذا، فإن تيكاغريلور مضاد استطباب عند مرضى الاعتلال الكبدي الشديد واستخدامه يجب أن يؤخذ بحذر عند مرضى الاعتلال الكبدي المتوسط الشدة.
لا حاجة لتعديل الجرعة عند مرضى الاعتلال الكبدي الخفيف.
الاعتلال الكلوي:
لا حاجة لتعديل الجرعة عند المرضى الاعتلال الكلوي. لم تتم دراسة المرضى الذين يخضعون للديال الدموي.
الجرعة وطريقة الاستعمال:
يبدأ العلاج بـ تيكاغريلور بـ ١٨٠ ملغ (مضغوطتين ٩٠ ملغ) كجرعة تحميل وتستمر المعالجة بـ ٩٠ ملغ مرتين يومياً خلال السنة الأولى من حادثة متلازمة الشريان التاجي الحادة.
يستخدم بعد سنة واحدة ٦٠ملغ مرتين في اليوم. لايستخدم التيكاغريلور مع مثبط آخر لمستقبل الصفيحات P2Y12
بعد جرعة التحميل البدئية من الأسبيرين (عادةً ٣٢٥ ملغ)، يستخدم تيكاغريلور مع جرعة صيانة يومية من الأسبيرين ٧٥-١٠٠ ملغ.
إن نسي المريض تناول جرعة من تيكاغريلور فعليه تناول مضغوطة واحدة ٩٠ ملغ (في موعد الجرعة القادمة) وفي وقتها المحدد (دون مضاعفة الجرعة).
فرط الجرعة:
لا يوجد حالياً علاج لعكس تأثيرات تيكاغريلور ومن غير المتوقع أن يتم التخلص من التيكاغريلور عبر الديال الدموي. يجب علاج فرط الجرعة باتباع الممارسة الطبية العيارية المحلية. إن النزف هو التأثير المتوقع فارماكولوجياً لفرط الجرعة. إن حدث نزف، يجب اتخاذ إجراءات داعمة مناسبة.
قد تتضمن التأثيرات الأخرى لفرط الجرعة تأثيرات معدية معوية (عثيان، إقياء، إسهال) أو توقفات بطينية. يجب مراقبة مخطط كهربائية القلب.
التعبئة: علبة من الكرتون تحوي شريط بلستر عدد٣ وكل شريط يحوي ١٠مضغوطات ملبسة بالفيلم.
علبة من الكرتون تحوي شريط بلستر عدد ١ وكل شريط يحوي ١٠مضغوطات ملبسة بالفيلم.
شروط الحفظ: يحفظ في درجة حرارة الغرفة ١٥°- ٣٠°م.
يحفظ بعيداً عن متناول الأطفال.

0797 Ed02 09/2020

*** هذا دواء ***

- لاتترك الأدوية في متناول أيدي الأطفال.
- الدواء مستحضر يؤثر على صحتك واستهلاكه خلافاً للتعليمات يعرضك للخطر .
- اتبع بدقة وصفة الطبيب وطريقة الاستعمال المنصوص عليها وتعليمات الصيدلي الذي صرفها لك.
- الطبيب والصيدلي هما الخبيران بالدواء وبنفعه وضره.
- لا تقطع مدة العلاج المحددة لك من تلقاء نفسك .
- لا تكرر صرف الدواء من دون وصفة طبية .

(مجلس وزراء الصحة العرب) (اتحاد الصيادلة العرب)

مختبرات ميديوتيك للصناعات الدوائية
ص.ب ٤١٤ - حمص - سوريا - هاتف : ٢٠٠٠