Доломин



Полезные ссылки:

Цена в Яндексе Горздрав Столички Апрель
Госреестр Википедия Реестр ЕАЭС
РЛС VIDAL Mail.Ru Drugs.com[англ]

Форма выпуска:

Раствор для в/в и в/м введения прозрачный, светло-желтого цвета.

	1 мл
кеторолака трометамин	30 мг

Вспомогательные вещества: этанол - 100 мг, натрия хлорид - 4.35 мг, натрия гидроксид или хлористоводородная кислота (pH 6.9-7.9), вода д/и - до 1 мл.

1 мл - ампулы темного стекла (5) - упаковки ячейковые контурные (1) - пачки картонные.
1 мл - ампулы темного стекла (5) - упаковки контурные ячейковые (2) - пачки картонные.

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Нестероидный противовоспалительный препарат (НПВП). Оказывает выраженное анальгезирующее действие, обладает противовоспалительным и умеренным жаропонижающим действием. Механизм действия связан с неселективным угнетением активности циклооксигеназы-1 и циклооксигеназы-2, катализирующей образование простагландинов (Pg) из арахидононовой кислоты, которые играют важную роль в патогенезе боли, воспаления и лихорадки. По силе анальгезирующего эффекта сопоставим с морфином, значительно превосходит другие НПВП. После внутримышечного введения начало анальгезирующего действия отмечается через 30 мин, максимальный эффект достигается через 1-2 ч.

Фармакокинетика

Максимальное накопление в тканях (C_{max}): 30 мг - 1,5-3 мкг/мл, 60 мг - 3-5,5 мкг/мл. T_{max} - 15-70 мин. C_{max} после внутривенной инфузии 15 мг - 1,5-3 мкг/мл, 30 мг - 3-5 мкг/мл. Связь с белками плазмы - 99 %.

C_{ss} - 24 ч при назначении 4 раза/сут (выше субтерапевтической) и составляет при внутримышечном введении 15 мг - 0,5- 1 мкг/мл, 30 мг - 1-2,5 мкг/мл, при внутривенной инфузии 15 мг - 0,5-1 мкг/мл, 30 мг - 1,5-3 мкг/мл. V_d - 0,15-0,3 л/кг. У больных с почечной недостаточностью объем распределения кеторолака может увеличиваться в 2 раза, а объем распределения его R-энантиомера - на 20 %. Проникает в грудное молоко: при приеме матерью 10 мг кеторолака C_{max} в молоке достигается через 2 ч после приема первой дозы и составляет 7 мг/мл, через 2 ч после применения второй дозы кеторолака (при использовании препарата 4 раза/сут) - 8 мг/мл. Более 50 % введенной дозы метаболизируется в печени с образованием фармакологически неактивных метаболитов. Главными метаболитами являются глюкурониды, которые выводятся почками, и р-гидроксикеторолак. Выводится на 90 % почками, 6 % - через кишечник. $T_{1/2}$ у пациентов с нормальной функцией почек - в среднем 5 ч. $T_{1/2}$ возрастает у пожилых пациентов и укорачивается у молодых. Функция печени не оказывает влияния на $T_{1/2}$. У пациентов с нарушением функции почек при концентрации креатинина в плазме 20-50 мг/л $T_{1/2}$ - 10-11 ч, при более выраженной почечной недостаточности - более 13 ч. Не выводится путем гемодиализа.

Показания к применению:

Болевой синдром сильной и умеренной выраженности при следующих состояниях:

— травма;

— зубная боль;

— боли в послеоперационном периоде;

— онкологические заболевания;

— миалгия;

— артралгия;

— невралгия;

— радикулит;

— вывихи, растяжения;

— ревматические заболевания.

Предназначен для симптоматической терапии, уменьшения боли и воспаления на момент применения, на прогрессирование заболевания не влияет.

Относится к болезням:

- Артралгия
- Артрит
- Артроз
- Воспаление
- Вывих
- Вывихи
- Зубная боль
- Миалгия
- Невралгия
- Неврит
- Радикулит
- Растяжение
- Ревматизм
- Ревматические заболевания
- Травмы

Противопоказания:

— гиперчувствительность к активному веществу или вспомогательным компонентам;

— полное или неполное сочетание бронхиальной астмы, рецидивирующего полипоза носа и околоносовых пазух и непереносимости ацетилсалициловой кислоты или др. НПВП (в т.ч. в анамнезе);

— крапивница, ринит, вызванные приемом НПВП (в анамнезе);

— непереносимость лекарственных средств пиразолонового ряда;

— гиповолемия (независимо от вызвавшей ее причины);

— эрозивно-язвенные поражения желудочно-кишечного тракта ЖКТ в стадии обострения;

— гипокоагуляция (в т.ч. гемофилия);

— кровотечения или высокий риск их развития;

— тяжелая почечная недостаточность (клиренс креатинина менее 30 мл/мин),

— тяжёлая печеночная недостаточность или активное заболевание печени;

— состояние после проведения аортокоронарного шунтирования;

— подтверждённая гиперкалиемия;

— воспалительные заболевания кишечника;

— беременность (III триместр);

— период родов, период лактации;

— детский возраст до 16 лет (безопасность и эффективность применения не установлены).

С осторожностью: бронхиальная астма, наличие факторов, повышающих токсичность в отношении ЖКТ: алкоголизм и холецистит, хроническая сердечная недостаточность, отечный синдром; артериальная гипертензия, нарушение функции почек, холестаз, сепсис, одновременный прием с другими НПВП, пожилой возраст (старше 65 лет), беременность (I триместр).

Ишемическая болезнь сердца, цереброваскулярные заболевания, дислипидемия/гиперлипидемия, сахарный диабет, заболевания периферических артерий, курение, клиренс креатинина 30-60 мл/мин.

Анамнестические данные о развитии язвенного поражения ЖКТ, подтвержденный факт наличия инфекции Helicobacter pylori, длительное использование НПВП, тяжелые соматические заболевания, сопутствующая терапия следующими препаратами: антикоагулянты (в т.ч. варфарин); антиагреганты (в т.ч. ацетилсалициловая кислота, клопидогрел); селективные ингибиторы обратного захвата серотонина (в т.ч. циталопрам, флуоксетин, пароксетин, сертралин); глюкокортикостероиды (в т.ч. преднизолон). Для снижения риска развития нежелательных явлений со стороны ЖКТ следует использовать минимальную эффективную дозу минимально возможным коротким курсом.

Способ применения и дозы:

Применяется в/м, в/в. При в/в введении дозу необходимо вводить не менее чем за 15 с (для лекарственных форм, содержащих этанол).

Пациентам от 16 до 64 лет с массой тела, превышающей 50 кг, в/м за 1 введение вводят не более 60 мг (включая пероральную дозу); обычно по 30 мг каждые 6 ч; в/в - по 30 мг (не более 15 доз за 5 сут).

В/м **взрослым пациентам с массой тела менее 50 кг** или с *хронической почечной недостаточностью (ХПН)* за I введение вводят не более 30 мг (включая пероральную дозу); обычно - по 15 мг (не более 20 доз за 5 сут); в/в - не более 15 мг каждые 6 ч (не более 20 доз за 5 сут).

Максимальные суточные дозы для в/м и в/в введения составляют для **пациентов от 16 до 64 лет с массой тела, превышающей 50 кг** - 90 мг/сут; **взрослым пациентам с массой тела менее 50 кг** или с *ХПН*, а также **пожилым пациентам (старше 65 лет)** - для в/м и в/в введения 60 мг. Длительность лечения не должна превышать 5 сут.

Побочное действие:

Часто - более 3 %, менее часто -1-3 %, редко - менее 1 %.

Со стороны пищеварительной системы: часто - гастралгия, диарея; менее часто - стоматит, метеоризм, запор, рвота, ощущение переполнения желудка; редко - снижение аппетита, тошнота, эрозивно-язвенные поражения ЖКТ (в т.ч. с перфорацией и/или кровотечением - боль в животе, спазм или жжение в эпигастральной области, кровь в кале или мелена, рвота с кровью или по типу "кофейной гущи", тошнота, изжога и др.), холестатическая желтуха, гепатит, гепатомегалия, острый панкреатит.

Со стороны мочевыделительной системы: редко - острая почечная недостаточность, боль в пояснице, гематурия, азотемия, гемолитико-уремический синдром (гемолитическая анемия, почечная недостаточность, тромбоцитопения, пурпура), учащение мочеиспускания, повышение или снижение объема мочи, нефрит, отеки почечного генеза.

Со стороны органов чувств: редко - снижение слуха, звон в ушах, нарушение зрения (в т.ч. нечеткость зрительного восприятия).

Со стороны дыхательной системы: редко - бронхоспазм, ринит, отек легких, отек гортани (одышка, затруднение дыхания).

Со стороны ЦНС: часто - головная боль, головокружение, сонливость, редко - асептический менингит (лихорадка, сильная головная боль, судороги, ригидность мышц шеи и/или спины), гиперактивность (изменение настроения, беспокойство), галлюцинации, депрессия, психоз, обморок.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: менее часто - повышение артериального давления.

Со стороны органов кроветворения: редко - анемия, эозинофилия, лейкопения.

Со стороны системы гемостаза: редко - кровотечение из послеоперационной раны, носовое кровотечение, ректальное кровотечение.

Со стороны кожных покровов: менее часто - кожная сыпь (включая макулопапулезную сыпь), пурпура, редко - эксфолиативный дерматит (лихорадка с ознобом или без, гиперемия, уплотнение или шелушение кожи, увеличение и/или болезненность небных миндалин), крапивница, злокачественная экссудативная эритема (синдром Стивенса-Джонсона), токсический эпидермальный некролиз (синдром Лайелла).

Местные реакции: менее часто - жжение или боль в месте введения.

Аллергические реакции: редко - анафилаксия или анафилактоидные реакции (изменение цвета кожи лица, кожная сыпь, крапивница, зуд кожи, тахипноэ или диспноэ, отеки век, периорбитальный отек, одышка, затрудненное дыхание, тяжесть в грудной клетке, свистящее дыхание).

Прочие: часто - отеки (лица, голеней, лодыжек, пальцев, ступней, повышение массы тела); менее часто - повышенное потоотделение, редко – лихорадка.

Передозировка:

Симптомы: боль в животе, тошнота, рвота, эрозивно-язвенное поражение ЖКТ, нарушение функции почек, метаболический ацидоз.

Лечение: симптоматическое (поддержание жизненно важных функций организма). Диализ - малоэффективен.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Проникает в грудное молоко в незначительных количествах. Применение в III триместре беременности и при кормлении грудью противопоказано (следует отказаться от кормления на период применения препарата). В крайних случаях при необходимости использования препарата во время I и II триместров беременности следует сопоставить пользу для матери и риск для плода.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Совместное применение с парацетамолом повышает нефротоксичность кеторолака. Прием с другими НПВП, глкжокортикостероидными средствами, этанолом, кортикотропином, препаратами кальция увеличивает риск изъязвления слизистой оболочки ЖКТ и развития желудочно-кишечных кровотечений. Одновременное применение с антикоагулянтными лекарственными средствами - производными кумарина и индандиона, гепарином, тромболитиками (алтеплаза, стрептокиназа, урокиназа), антиагрегантными лекарственными средствами, цефалоспоринами, вальпроевой кислотой и аминосалициловой кислотой повышает риск развития кровотечений. Снижает эффект гипотензивных и диуретических ЛС (снижает синтез Pg в почках). Применение совместно с метотрексатом повышает гепато- и нефротоксичность кеторолака (совместное их применение возможно только при использовании низких доз последнего и контроле его концентрации в плазме). При применении с другими нефротоксичными лекарственными средствами (в том числе с препаратами золота) повышается риск развития нефротоксичности.

Лекарственные средства, блокирующие канальцевую секрецию, снижают клиренс кеторолака и повышают его концентрацию в плазме. Повышает эффект наркотических анальгетиков. Миелотоксичные ЛС усиливают проявления гематотоксичности препарата.

Особые указания и меры предосторожности:

Перед назначением препарата необходимо выяснить вопрос о предшествующей аллергии на препарат или НПВП. Из-за риска развития аллергических реакций введение первой дозы проводят под тщательным наблюдением врача. Гиповолемия повышает риск развития нефротоксических побочных реакций. При необходимости можно назначать в комбинации с наркотическими анальгетиками. Не рекомендуется применять для премедикации, поддержания анестезии.

При совместном применении с другими НПВП могут наблюдаться задержка жидкости, декомпенсация сердечной деятельности, повышение артериального давления. Влияние на агрегацию тромбоцитов прекращается через 24-48 ч. Не использовать одновременно с парацетамолом более 5 сут.

Больным с нарушением свертывания крови назначают только при постоянном контроле числа тромбоцитов, особенно важно для послеоперационных больных, требующих тщательного контроля гемостаза.

Риск развития лекарственных осложнений возрастает при удлинении лечения (у больных с хроническими болями) и повышении дозы препарата.

Для снижения риска развития НПВП- гастропатии назначают мизопростол, омепразол.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

В период лечения необходимо соблюдать осторожность при вождении автотранспорта и занятии др. потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций.

При нарушениях функции почек

Противопоказан при тяжелой почечной недостаточности (клиренс креатинина менее 30 мл/мин).

С осторожностью: нарушение функции почек.

При нарушениях функции печени

Противопоказан при тяжелой печеночной недостаточности или активном заболевании печени.

Применение в пожилом возрасте

С осторожностью: пожилой возраст (старше 65 лет).

Применение в детском возрасте

Противопоказан в детском возрасте до 16 лет (безопасность и эффективность применения не установлены).

Условия хранения:

Хранить в недоступном для детей и защищенном от света месте при температуре от 15 до 25 °С.

Срок годности:

4 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

Источник: http://drugs.thead.ru/Dolomin