Кетолак



Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- Кеторолак

Полезные ссылки:

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

Фармакотерапевтическая группа:

- Ненаркотические анальгетики, включая нестероидные и другие противовоспалительные средства

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

НПВС, производное пирролизин-карбоксиловой кислоты. Оказывает выраженное анальгезирующее действие, обладает также противовоспалительным и умеренным жаропонижающим действием. Механизм действия связан с угнетением активности ЦОГ - основного фермента метаболизма арахидоновой кислоты, являющейся предшественником простагландинов, которые играют главную роль в патогенезе воспаления, боли и лихорадки.

Фармакокинетика

При приеме внутрь абсорбируется из ЖКТ. C_{max} в плазме крови достигается через 40-50 мин как после приема внутрь, так и после в/м введения. Прием пищи не оказывает влияния на абсорбцию. Связывание с белками плазмы составляет более 99%.

$T_{1/2}$ - 4-6 ч как после приема внутрь, так и после в/м введения.

Более 90% дозы выводится с мочой, в неизмененном виде - 60%; остальное количество - через кишечник.

У пациентов с нарушениями функции почек и лиц старческого возраста скорость выведения снижается, $T_{1/2}$ увеличивается.

Показания к применению:

Для кратковременного купирования умеренных и сильных болей различного генеза.

Противопоказания:

Эрозивно-язвенные поражения ЖКТ в фазе обострения, наличие или подозрение на желудочно-кишечное

кровотечение и/или черепно-мозговое кровоизлияние, нарушения свертывания крови в анамнезе, состояния с высоким риском кровотечения или неполного гемостаза, геморрагический диатез, умеренные и выраженные нарушения функции почек (содержание сывороточного креатинина более 50 мг/л), риск развития почечной недостаточности при гиповолемии и дегидратации; "аспириновая триада", бронхиальная астма, полипы полости носа, ангионевротический отек в анамнезе, профилактическое обезболивание перед операцией и во время операции, детский и подростковый возраст до 16 лет, беременность, роды, лактация, повышенная чувствительность к кеторолаку, ацетилсалициловой кислоте и другим НПВС.

Способ применения и дозы:

Взрослым при приеме внутрь - по 10 мг каждые 4-6 ч, в случае необходимости - по 20 мг 3-4 раза/сут.

При в/м введении разовая доза - 10-30 мг, интервал между введениями - 4-6 ч. Максимальная длительность применения - 2 сут.

Максимальные дозы: при приеме внутрь или в/м введении - 90 мг/сут; для пациентов с массой тела до 50 кг, при нарушениях функции почек, а также для лиц старше 65 лет - 60 мг/сут.

Побочное действие:

Со стороны сердечно-сосудистой системы: редко - брадикардия, изменения АД, сердцебиение, обморок.

Со стороны пищеварительной системы: возможны тошнота, боли в животе, диарея; редко - запор, метеоризм, чувство переполнения ЖКТ, рвота, сухость во рту, жажда, стоматит, гастрит, эрозивно-язвенные поражения ЖКТ, нарушения функции печени.

Со стороны ЦНС и периферической нервной системы: возможны беспокойство, головная боль, сонливость; редко - парестезии, депрессия, эйфория, нарушения сна, головокружение, изменение вкусовых ощущений, нарушения зрения, двигательные нарушения.

Со стороны дыхательной системы: редко - нарушение дыхания, приступы удушья.

Со стороны мочевыделительной системы: редко – учащение мочеиспускания, олигурия, полиурия, протеинурия, гематурия, азотемия, острая почечная недостаточность.

Со стороны системы свертывания крови: редко – носовые кровотечения, анемия, эозинофилия, тромбоцитопения, кровотечения из послеоперационных ран.

Со стороны обмена веществ: возможно усиление потоотделения, отеки; редко - олигурия, повышение уровня креатинина и/или мочевины в плазме крови, гипокалиемия, гипонатриемия.

Аллергические реакции: возможны кожный зуд, геморрагическая сыпь; в единичных случаях - эксфолиативный дерматит, крапивница, синдром Лайелла, синдром Стивенса-Джонсона, анафилактический шок, бронхоспазм, отек Квинке, миалгии.

Прочие: возможна лихорадка.

Местные реакции: боль в месте инъекции.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Противопоказан при беременности, во время родов и в период лактации (грудного вскармливания).

Кеторолак противопоказан для применения в качестве средства для премедикации, поддерживающей анестезии и для обезболивания в акушерской практике, поскольку под его влиянием возможно увеличение длительности первого периода родов. Кроме того, кеторолак может угнетать сократимость матки и кровообращение плода.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

При одновременном применении кеторолака с другими НПВС возможно развитие аддитивных побочных эффектов; с пентоксифиллином, антикоагулянтами (включая гепарин в низких дозах) - возможно увеличение риска кровотечения; с ингибиторами АПФ - возможно увеличение риска развития нарушений функции почек; с пробенецидом - увеличиваются концентрация кеторолака в плазме и период его полувыведения; с препаратами лития - возможно снижение почечного клиренса лития и повышение его концентрации в плазме; с фуросемидом - уменьшение его мочегонного действия.

При применении кеторолака уменьшается потребность в применении опиоидных анальгетиков с целью обезболивания.

Особые указания и меры предосторожности:

С осторожностью применяют у пациентов с нарушениями функции печени и почек, хронической сердечной недостаточностью, артериальной гипертензией, у больных с эрозивно-язвенными поражениями ЖКТ и кровотечениями из ЖКТ в анамнезе.

Следует с осторожностью применять кеторолак в послеоперационном периоде в случаях, когда требуется особенно тщательный гемостаз (в т.ч. после резекции предстательной железы, тонзиллэктомии, в косметической хирургии), а также у больных старческого возраста, т.к. период полувыведения кеторолака удлиняется, а плазменный клиренс может снижаться. У этой категории больных рекомендуется применять кеторолак в дозах, близких к нижней границе терапевтического диапазона. При появлении симптомов поражения печени, кожной сыпи, эозинофилии кеторолак следует отменить. Кеторолак не показан для применения при хроническом болевом синдроме.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

Если в период лечения кеторолаком появляются сонливость, головокружение, бессонница или депрессия, необходимо соблюдать особую осторожность во время занятий потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенного внимания и быстроты психомоторных реакций.

При нарушениях функции почек

Противопоказан при выраженных нарушениях функции почек (содержание сывороточного креатинина более 50 мг/л), риске развития почечной недостаточности при гиповолемии и дегидратации.

С осторожностью применяют у пациентов с нарушениями функции почек.

При нарушениях функции печени

С осторожностью применяют у пациентов с нарушениями функции печени.

Применение в пожилом возрасте

Следует с осторожностью применять кеторолак у больных старческого возраста, т.к. период полувыведения кеторолака удлиняется, а плазменный клиренс может снижаться. У этих больных рекомендуется применять кеторолак в дозах, близких к нижней границе терапевтического диапазона.

Применение в детском возрасте

Противопоказан в детском и подростковом возрасте до 16 лет.

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