

Кеторол



Код АТХ:

- [M01AB15](#)

Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- [Кеторолак](#)

Полезные ссылки:

[Цена в Яндексe](#) [Горздрав](#) [Столички](#) [Апрель](#)
[Госреестр](#)^{МНН} [Википедия](#)^{МНН}
[РЛС VIDAL](#) [Mail.Ru](#) [Drugs.com](#)^{англ}

Форма выпуска:

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой 10 шт. - блистеры (2) - пачки картонные.

Раствор для внутримышечного введения 1 мл - ампулы темного стекла (10) - блистеры.

Состав:

Одна таблетка, покрытая пленочной оболочкой содержит

Активное вещество: кеторолака трометамин (кеторолака трометамол) 10 мг

Вспомогательные вещества: МКЦ, лактоза, крахмал кукурузный, кремния диоксид коллоидный, магния стеарат, карбоксиметилкрахмал натрия (тип А)

Состав оболочки: гипромеллоза, пропиленгликоль, титана диоксид, олив зеленый (краситель хинолиновый желтый, краситель бриллиантовый голубой).

1 мл раствора для внутримышечного введения содержит

Активное вещество: кеторолака трометамин (кеторолака трометамол) 30 мг

Вспомогательные вещества: натрия хлорид, спирт, динатрия эдетат, октоксинол, пропиленгликоль, натрия гидроксид, вода для инъекций.

Описание:

Таблетки: круглые, двояковыпуклые, покрытые оболочкой зеленого цвета, на одной стороне тиснение — буква «S». Вид на поперечном срезе: оболочка зеленого цвета и ядро белого или почти белого цвета.

Раствор для в/м введения: прозрачный бесцветный или бледно-желтый раствор.

Фармакотерапевтическая группа:

- [Ненаркотические анальгетики, включая нестероидные и другие противовоспалительные средства](#)

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

НПВС. Кеторолак оказывает выраженное анальгезирующее действие, обладает также противовоспалительным и умеренным жаропонижающим действием.

Механизм действия связан с неселективным угнетением активности ферментов ЦОГ-1 и ЦОГ-2, главным образом в периферических тканях, следствием чего является торможение биосинтеза простагландинов - модуляторов болевой чувствительности, терморегуляции и воспаления. Кеторолак представляет собой рацемическую смесь [-]S- и [+]R-энантиомеров, при этом анальгезирующее действие обусловлено [-]S-энантиомером.

Препарат не влияет на опиоидные рецепторы, не угнетает дыхание, не вызывает лекарственной зависимости, не обладает седативным и анксиолитическим действием.

По силе анальгезирующего эффекта сопоставим с морфином, значительно превосходит другие НПВС.

После в/м введения и приема препарата внутрь начало анальгезирующего действия отмечается соответственно через 30 мин и 1 ч, максимальный эффект достигается через 1-2 ч.

Фармакокинетика

Всасывание. После приема внутрь кеторолак хорошо всасывается из ЖКТ. C_{max} в плазме крови достигается через 40 мин после приема препарата натошак в дозе 10 мг и составляет 0.7-1.1 мкг/мл. Богатая жирами пища снижает C_{max} кеторолака в крови и задерживает время достижения C_{max} на 1 ч.

Биодоступность - 80-100%.

После в/м введения кеторолак быстро и полностью всасывается из места инъекции в системный кровоток. После в/м введения препарата в дозе 30 мг C_{max} в плазме крови составляет 1.74-3.1 мкг/мл, в дозе 60 мг - 3.23-5.77 мкг/мл, время достижения C_{max} соответственно - 15-73 мин и 30-60 мин.

Распределение. Связывание с белками плазмы составляет 99%. При гипоальбуминемии количество свободного вещества в крови увеличивается.

Время достижения C_{ss} при парентеральном и пероральном введении - 24 ч при назначении препарата 4 раза/сут (выше субтерапевтической) и составляет при в/м введении препарата в дозе 15 мг - 0.65-1.13 мкг/мл, в дозе 30 мг - 1.29-2.47 мкг/мл; после приема внутрь препарата в дозе 10 мг - 0.39-0.79 мкг/мл. V_d составляет 0.15-0.33 л/кг.

Проникает в грудное молоко. При назначении препарата в дозе 10 мг 4 раза/сут C_{max} в грудном молоке достигается через 2 ч после приема первой дозы и составляет 7.3 нг/мл, через 2 ч после приема второй дозы C_{max} составляет 7.9 нг/л.

Метаболизм. Более 50% введенной дозы метаболизируется в печени с образованием фармакологически неактивных метаболитов. Главными метаболитами являются глюкурониды и p-гидроксикеторолак.

Выведение. Выводится почками (91%) и через кишечник (6%). Глюкурониды выводятся с мочой.

$T_{1/2}$ у пациентов с нормальной функцией почек составляет в среднем 5.3 ч (3.5-9.2 ч после в/м введения препарата в дозе 30 мг и 2.4-9 ч после приема внутрь в дозе 10 мг).

Общий клиренс составляет при в/м введении препарата в дозе 30 мг - 0.023 л/кг/ч, при приеме внутрь в дозе 10 мг - 0.025 л/кг/ч.

Фармакокинетика в особых клинических случаях. У больных с почечной недостаточностью V_d кеторолака может увеличиваться в 2 раза, а V_d R-энантиомера - на 20%.

$T_{1/2}$ удлиняется у пожилых пациентов и укорачивается у молодых пациентов. Функция печени не оказывает влияния на $T_{1/2}$. У пациентов с нарушением функции почек при концентрации креатинина в плазме крови 19-50 мг/л (168-442 мкмоль/л) $T_{1/2}$ составляет 10.3-10.8 ч, при более выраженной почечной недостаточности - более 13.6 ч.

Общий клиренс у пациентов с почечной недостаточностью при концентрации креатинина в плазме крови 19-50 мг/л при в/м введении препарата в дозе 30 мг - 0.015 л/кг/ч (0.019 л/кг/ч - у пожилых пациентов), при приеме внутрь в дозе 10 мг - 0.016 л/кг/ч.

Не выводится при гемодиализе.

Показания к применению:

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой:

— болевой синдром сильной и умеренной выраженности (предназначен для симптоматической терапии, уменьшения интенсивности боли и воспаления на момент использования; на прогрессирование заболевания не влияет):

- травмы;
- зубная боль;
- боли в послеродовом и послеоперационном периоде;
- онкологические заболевания;
- миалгия, артралгия, невралгия, радикулит;
- вывихи, растяжения;
- ревматические заболевания.

Раствор для в/м введения:

— болевой синдром средней и сильной интенсивности различного генеза (в т.ч. боли в послеоперационном периоде, при онкологических заболеваниях).

Относится к болезням:

- [Артралгия](#)
- [Болевой синдром](#)
- [Вывихи](#)
- [Зубная боль](#)
- [Миалгия](#)
- [Невралгия](#)
- [Радикулит](#)
- [Растяжение](#)
- [Ревматические заболевания](#)
- [Травмы](#)

Противопоказания:

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой:

- повышенная чувствительность к кеторолаку;
- полное или неполное сочетание бронхиальной астмы, рецидивирующего полипоза носа или околоносовых пазух и непереносимости ацетилсалициловой кислоты и других НПВС (в т.ч. в анамнезе);
- эрозивно-язвенные изменения слизистой оболочки желудка и двенадцатиперстной кишки, активное желудочно-кишечное кровотечение; цереброваскулярное или иное кровотечение;
- воспалительные заболевания кишечника (болезнь Крона, язвенный колит) в фазе обострения;
- гемофилия и другие нарушения свертываемости крови;
- декомпенсированная сердечная недостаточность;
- печеночная недостаточность или активное заболевание печени;

- выраженная почечная недостаточность (Cl креатинина <30 мл/мин), прогрессирующие заболевания почек, подтвержденная гиперкалиемия;
- период после проведения аорто-коронарного шунтирования;
- дефицит лактазы, непереносимость лактозы, глюкозо-галактозная мальабсорбция;
- беременность, роды;
- период лактации;
- детский возраст до 16 лет.

С осторожностью:

- повышенная чувствительность к другим НПВС;
- бронхиальная астма;
- ИБС;
- застойная сердечная недостаточность;
- отечный синдром;
- артериальная гипертензия;
- цереброваскулярные заболевания;
- патологическая дислипидемия/гиперлипидемия;
- нарушение функции почек (Cl креатинина 30–60 мл/мин);
- сахарный диабет;
- холестаза, активный гепатит;
- сепсис;
- системная красная волчанка;
- заболевания периферических артерий;
- курение;
- одновременный прием с другими НПВС;
- пожилой возраст (старше 65 лет);
- анамнестические данные о развитии язвенного поражения ЖКТ;
- злоупотребление алкоголем;
- тяжелые соматические заболевания;
- сопутствующая терапия следующими препаратами: антикоагулянты (например варфарин), антиагреганты (например ацетилсалициловая кислота, клопидогрел), пероральные ГКС (например преднизолон), селективные ингибиторы обратного захвата серотонина (например циталопрам, флуоксетин, пароксетин, сертралин).

Раствор для в/м введения:

- повышенная чувствительность к кеторолаку или другим НПВС;
- аспиринная астма, бронхоспазм, ангионевротический отек;
- гиповолемия (независимо от вызвавшей ее причины), дегидратация;
- эрозивно-язвенные поражения ЖКТ в стадии обострения, пептические язвы;
- гипокоагуляция (в т.ч. гемофилия);
- печеночная и/или почечная недостаточность (креатинин плазмы выше 50 мг/л);
- геморрагический инсульт (подтвержденный или подозреваемый), геморрагический диатез;

- высокий риск развития кровотечения или его рецидива (в т.ч. после операций);
- нарушение кроветворения;
- одновременный прием с другими НПВС;
- беременность, роды;
- период лактации;
- детский возраст до 16 лет;
- обезболивание перед и во время хирургических операций из-за высокого риска кровотечения;
- хронические боли.

С осторожностью:

- бронхиальная астма;
- холецистит, холестаз, активный гепатит;
- хроническая сердечная недостаточность;
- артериальная гипертензия;
- нарушение функции почек (креатинин плазмы ниже 50 мг/л);
- сепсис;
- системная красная волчанка;
- пожилой возраст (старше 65 лет);
- полипы слизистой оболочки носа и носоглотки.

Способ применения и дозы:

Таблетки: Кеторол назначают внутрь однократно или повторно в зависимости от тяжести болевого синдрома. Однократно - в дозе 10 мг, при повторном приеме - по 10 мг до 4 раз/сут в зависимости от выраженности боли. Максимальная суточная доза не должна превышать 40 мг.

Продолжительность курса лечения при приеме внутрь не должна превышать 5 дней.

Раствор для инъекций: вводят глубоко в/м в минимально эффективных дозах, подобранных в соответствии с интенсивностью боли и реакцией больного. При необходимости одновременно можно дополнительно назначить опиоидные анальгетики в уменьшенных дозах.

Взрослым в возрасте до 65 лет препарат назначают в/м в дозе 10-30 мг однократно или в зависимости от тяжести болевого синдрома по 10-30 мг каждые 4-6 ч.

Пожилым пациентам в возрасте старше 65 лет или с нарушениями функции почек препарат назначают в/м в дозе 10-15 мг однократно или в зависимости от тяжести болевого синдрома по 10-15 мг каждые 4-6 ч.

При в/м введении максимальная суточная доза для больных в возрасте до 65 лет - 90 мг, для больных старше 65 лет или с нарушениями функции почек - 60 мг.

Продолжительность курса лечения при парентеральном введении не должна превышать 5 дней.

При переходе с парентерального введения препарата на прием внутрь суммарная суточная доза обеих лекарственных форм в день перевода для больных в возрасте до 65 лет не должна превышать 90 мг, для больных в возрасте старше 65 лет или с нарушениями функции почек - 60 мг. При этом доза препарата для приема внутрь в день перехода не должна превышать 30 мг.

Побочное действие:

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

Со стороны пищеварительной системы: часто (особенно у пожилых пациентов, старше 65 лет, имеющих в анамнезе эрозивно-язвенные поражения ЖКТ) — гастралгия, диарея; менее часто — стоматит, метеоризм, запор, рвота, ощущение переполнения желудка; редко — тошнота, эрозивно-язвенные поражения ЖКТ (в т.ч. с перфорацией и/или кровотечением — абдоминальная боль, спазм или жжение в эпигастриальной области, мелена, рвота 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 с или без гематурии и/или азотемии, гемолитический уремический синдром (гемолитическая анемия, почечная недостаточность, тромбоцитопения, пурпура), частое мочеиспускание, 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 или диспноэ, ринит, 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.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: менее часто — повышение АД; редко — отек легких, обморок.

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 него, покраснение, уплотнение или шелушение кожи, опухание и/или болезненность небных миндалин), крапивница, синдром Стивенса-Джонсона, 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, увеличение массы тела); менее часто — повышенная потливость; редко — отек языка, лихорадка.

Передозировка:

Симптомы: абдоминальные боли, тошнота, рвота, возникновение пептических язв желудка или эрозивного гастрита, нарушение функции почек, метаболический ацидоз.

Лечение: промывание желудка, введение адсорбентов (активированный уголь), симптоматическая терапия (поддержание жизненно важных функций организма). Не выводится в достаточной степени с помощью диализа.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Противопоказано при беременности. На время лечения следует прекратить грудное вскармливание.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Одновременное применение кеторолака с ацетилсалициловой кислотой или другими НПВС, препаратами кальция, ГКС, этанолом, кортикотропином может привести к образованию язв ЖКТ и развитию желудочно-кишечных кровотечений.

Совместное назначение Кеторола с парацетамолом повышает риск развития нефротоксичности, с метотрексатом - гепато- и нефротоксичности.

На фоне применения кеторолака возможно уменьшение клиренса метотрексата и лития и усиление токсичности этих веществ. Совместное назначение кеторолака и метотрексата возможно только при использовании низких доз последнего (при этом следует контролировать концентрацию метотрексата в плазме крови).

Пробенецид уменьшает плазменный клиренс и объем распределения кеторолака, повышает концентрацию в плазме

крови и увеличивает период полувыведения последнего.

Одновременное назначение с непрямыми антикоагулянтами, гепарином, тромболитиками, антиагрегантами, цефоперазоном, цефотетаном и пентоксифиллином повышает риск развития кровотечения.

Кеторол снижает эффект антигипертензивных и диуретических препаратов (т.к. снижается синтез простагландинов в почках).

При комбинировании Кеторола с опиоидными анальгетиками дозы последних могут быть существенно снижены.

Антацидные средства не влияют на всасывание кеторолака.

При одновременном применении с Кеторолом повышается гипогликемическое действие инсулина и пероральных гипогликемических препаратов (поэтому необходим перерасчет дозы).

Совместное назначение Кеторола с натрия вальпроатом вызывает нарушение агрегации тромбоцитов.

Кеторолак повышает концентрации верапамила и нифедипина в плазме крови.

При назначении Кеторола с другими нефротоксичными лекарственными средствами (в т.ч. с препаратами золота) повышается риск развития нефротоксичности.

Лекарственные препараты, блокирующие канальцевую секрецию, снижают клиренс кеторолака и повышают его концентрацию в плазме крови.

Фармацевтическое взаимодействие

Раствор для инъекций не следует смешивать в одном шприце с морфина сульфатом, прометазинном и гидроксизинном из-за выпадения осадка.

Фармацевтически несовместим с раствором трамадола, препаратами лития.

Раствор для инъекций совместим с физиологическим раствором, 5% раствором декстрозы, раствором Рингера и раствором Рингера-лактата, раствором Плазмалит, а также с инфузионными растворами, содержащими аминафиллин, лидокаина гидрохлорид, допамина гидрохлорид, инсулин человеческий короткого действия и гепарина натриевую соль.

Особые указания и меры предосторожности:

Кеторол® имеет две лекарственные формы (таблетки, покрытые оболочкой, и раствор для инъекций). Выбор способа введения препарата зависит от степени выраженности болевого синдрома и состояния больного.

Влияние на агрегацию тромбоцитов прекращается через 24-48 ч.

Гиповолемия повышает риск развития побочных реакций со стороны почек. При необходимости можно назначать в комбинации с наркотическими анальгетиками.

Кеторол® не рекомендуется применять в качестве средства для премедикации, поддерживающей анестезии и обезболивания в акушерской практике.

Не использовать одновременно с парацетамолом более 5 дней. Больным с нарушением свертывания крови препарат назначают только при постоянном контроле числа тромбоцитов (особенно важно в послеоперационном периоде; необходим тщательный контроль гемостаза).

Риск развития лекарственных осложнений возрастает при удлинении сроков лечения более 5 дней и повышении пероральной дозы препарата более 40 мг/сут. Не следует применять препарат одновременно с другими НПВС.

При совместном приеме с другими НПВС могут наблюдаться задержка жидкости, декомпенсация сердечной деятельности, повышение АД. Влияние на агрегацию тромбоцитов прекращается через 24-48 ч.

Препарат может изменять свойства тромбоцитов, однако не заменяет профилактического действия ацетилсалициловой кислоты при сердечно-сосудистых заболеваниях. Для снижения риска развития НПВС-гастропатии назначаются антацидные лекарственные средства, мизопростол, омепразол.

Поскольку у значительной части больных при назначении Кеторола® развиваются побочные эффекты со стороны ЦНС (сонливость, головокружение, головная боль), рекомендуется избегать выполнения работ, требующих повышенного внимания и быстрой реакции (вождение автотранспорта, работа с механизмами и пр.).

Условия хранения:

Кеторол

Фармакологическая база данных (<http://drugs.thead.ru>)

Препарат следует хранить в сухом, защищенном от света, недоступном для детей месте при температуре не выше 25°C.

Срок годности:

3 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

Источник: <http://drugs.thead.ru/Ketorol>