Кеторолак-Obl



Полезные ссылки:

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

Форма выпуска:

Таблетки, покрытые оболочкой белого или белого с кремоватым оттенком цвета, круглые, двояковыпуклые; на поперечном разрезе видны два слоя.

	1 таб.
кеторолака трометамин	10 мг

Вспомогательные вещества: лактоза, целлюлоза микрокристаллическая, магния стеарат, гидроксипропилметилцеллюлоза 15 СР, полиэтиленгликоль 6000, титана диоксид.

10 шт. - упаковки ячейковые контурные (2) - пачки картонные.

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

НПВП. Оказывает выраженное анальгезирующее действие, обладает также противовоспалительным и умеренным жаропонижающим действием. Механизм действия связан с неселективным угнетением активности ЦОГ-1 и ЦОГ-2, катализирующей образование простагландинов из арахидоновой кислоты, которые играют важную роль в патогенезе боли, воспаления и лихорадки. Кеторолак представляет собой рацемическую смесь [-]S и [+]R энантиомеров, при этом обезболивающее действие обусловлено [-]S формой. По силе анальгезирующего эффекта сопоставим с морфином, значительно превосходит другие НПВП.

После приема внутрь начало анальгезирующего действия отмечается через 0.5-1 ч, максимальный эффект достигается через 2-3 ч.

Фармакокинетика

Абсорбция при приеме внутрь - быстрая, биодоступность - 80-100% .C_{max} после перорального приема 10 мг - 0.7-1.1 мкг/мл, время достижения C_{max} - 10-78 мин.

C_{ss} достигается при пероральном приеме через 24 ч при назначении 4 раза/сут (выше субтерапевтической) и составляет после перорального приема 10 мг 0.39-0.79 мкг/мл. Связывание с белками плазмы - 99%. V_d - 0.15-0.33 л/кг. У больных с почечной недостаточностью V_d препарата может увеличиваться в 2 раза, а V_d его R-энантиомера - на 20%. Проникает в грудное молоко: при приеме матерью 10 мг кеторолака C_{max} в грудном молоке достигается через 2 ч после приема первой дозы и составляет 7.3 нг/мл, через 2 ч после применения второй дозы кеторолака (при использовании препарата 4 раза/сут) - 7.9 нг/л.

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

Выводится почками (91%), через кишечник (6%). Т

$T_{1/2}$у пациентов с нормальной функцией почек - около 9 ч, 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 19-50 мг/л (168-442 мкмоль/л) $T_{1/2}$ - 10.3-10.8 ч, при более выраженной почечной недостаточности - более 13.6 ч. Общий клиренс составляет при пероральном приеме 10 мг - 0.025 л/ч/кг; у пациентов с почечной недостаточностью при концентрации креатинина в плазме 19/50 мг/л при пероральном введении 10 мг - 0.016 л/ч/кг. Не выводится путем гемодиализа.

Показания к применению:

Болевой синдром сильной и умеренной выраженности: травмы, боли в послеродовом и послеоперационном периоде, онкологические заболевания, миалгия, артралгия, невралгия, радикулит.

Относится к болезням:

- Артралгия
- Артрит
- Артроз
- Миалгия
- Невралгия
- Неврит
- Радикулит
- Травмы

Противопоказания:

— "аспириновая" триада (сочетание бронхиальной астмы, рецидивирующего полипоза носа и околоносовых пазух и непереносимости ацетилсалициловой кислоты и лекарственных средств пиразолонового ряда);

— гиповолемия (независимо от вызвавшей ее причины);

— эрозивно-язвенные поражения ЖКТ в стадии обострения;

— гипокоагуляция (в т.ч. гемофилия);

— кровотечения или высокий риск их развития;

— тяжелая почечная недостаточность (креатинин плазмы выше 50 мг/л);

— печеночная недостаточность;

— период родов;

— период лактации;

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

— повышенная чувствительность к компонентам препарата.

С *осторожностью:* повышенная чувствительность к другим НПВП, бронхиальная астма, наличие факторов, повышающих токсичность в отношении ЖКТ (алкоголизм, табакокурение и холецистит), послеоперационный период, хроническая сердечная недостаточность, отечный синдром, артериальная гипертензия, нарушение функции почек (креатинин плазмы ниже 50 мг/л), холестаз, активный гепатит, сепсис, системная красная волчанка, одновременный прием с другими НПВП, пожилой возраст (старше 65 лет), беременность.

Способ применения и дозы:

Внутрь.

При пероральном применении **пациентам от 16 до 64 лет с массой тела, превышающей 50 кг,** рекомендуемая доза составляет 20 мг в первый прием, далее - по 10 мг 4 раза/сут, но не более 40 мг/сут; **взрослым пациентам с массой тела менее 50 кг или с почечной недостаточностью** - 10 мг в первый прием и далее - по 10 мг 4 раза/сут;

Максимальная суточная доза при пероральном применении составляет 40 мг.

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), 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 или диспноэ, 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, обморочные состояния.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: менее часто - повышение АД.

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 макулопапуллезную сыпь), пурпура; редко - эксфолиативный дерматит (лихорадка с ознобом или без, гиперемия, уплотнение или шелушение кожи, опухание и/или болезненность небных миндалин), крапивница, злокачественная экссудативная эритема (синдром Стивенса-Джонсона), токсический эпидермальный некролиз (синдром Лайелла).

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 - отек языка, лихорадка.

Передозировка:

Симптомы (при однократном введении): 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 в период кормления грудью противопоказано; в крайних ситуациях следует сопоставлять пользу для матери и риск для плода или ребенка.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Совместное назначение с парацетамолом повышает нефротоксичность кеторолака.

Прием с другими НПВП, ГКС, этанолом, кортикотропином, препаратами кальция увеличивает риск изъязвления слизистой оболочки ЖКТ и развития желудочно-кишечных кровотечений.

Одновременное назначение с антикоагулянтами - производными кумарина и индандиона, гепарином, тромболитиками (алтеплаза, стрептокиназа, урокиназа), антиагрегантами, цефалоспоринами, вальпроевой кислотой

и ацетилсалициловой кислотой - повышает риск развития кровотечений.

Снижает эффект гипотензивных и диуретических лекарственных средств (снижает синтез простагландина в почках).

Назначение совместно с метотрексатом повышает гепато- и нефротоксичность (совместное назначение возможно только при использовании низких доз последнего и контроле его концентрации в плазме).

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

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

Повышает эффект опиоидных анальгетиков.

Миелотоксичные лекарственные средства - усиление гематотоксичности.

Особые указания и меры предосторожности:

Гиповолемия повышает риск развития нефротоксических побочных реакций.

При необходимости можно назначать в комбинации с опиоидными анальгетиками.

Не рекомендуется применять в качестве лекарственного средства для премедикации, поддержания анестезии.

При совместном приеме с другими НПВП может наблюдаться задержка жидкости, декомпенсация сердечной деятельности, повышение АД.

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 более 40 мг/сут.

Для снижения риска развития НПВП-гастропатии назначаются антацидные лекарственные средства, мизопростол, омепразол.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

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

При нарушениях функции почек

С *осторожностью:* нарушение функции почек (креатинин плазмы ниже 50 мг/л).

При нарушениях функции печени

Противопоказание: печеночная недостаточность.

Применение в пожилом возрасте

С *осторожностью:* пожилой возраст (старше 65 лет).

Применение в детском возрасте

Противопоказание: детский возраст до 16 лет (безопасность и эффективность не установлены).

Условия хранения:

Список Б. Таблетки, покрытые оболочкой по 10 мг, хранят в сухом, защищенном от света и недоступном для детей месте при температуре не выше 25°С. Срок годности - 2 года, не использовать по истечении срока годности, указанного на упаковке.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

Источник: http://drugs.thead.ru/Ketorolak-Obl