Кеторолак Ромфарм



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 96% - 100 мг, натрия хлорид - 4.35 мг, динатрия эдетата дигидрат - 0.5 мг, 1М хлористоводородная кислота или натрия гидроксида раствор - до pH 7.4-7.5, 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 ячейковые контурные (2) - пачки картонные.

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

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

Начало анальгезирующего действия отмечается соответственно через 0.5 ч, максимальный эффект достигается через 1-2 ч.

Фармакокинетика

Всасывание

Биодоступность - полная и быстрая. После внутримышечного введения C_{max} в плазме составляет 1.74-3.1 мкг/мл, T_{max} - 15-73 мин; C_{max} после в/в введения - 3.69-5.61 мкг/мл.

Распределение

Связывание с белками плазмы - 99%. V_d - 0.15-0.33 л/кг.

Время достижения равновесной концентрации (C_{ss}) - 24 ч при назначении 4 раза/сут (больше чем рекомендуемая суточная доза) и составляет при в/м введении - 1.29-2.47 мкг/мл, при в/в введении - 1.68-2.76 мкг/мл.

Метаболизм

Более 50% введенной дозы метаболизируется в печени с образованием фармакологически неактивных метаболитов.

Главными метаболитами являются глюкурониды, которые выводятся почками, и p-гидроксикеторолак. Выводится на 91% почками, 6% - через кишечник.

Выведение

$T_{1/2}$ у пациентов с нормальной функцией почек - в среднем 5.3 ч (3.5-9.2 ч после в/м введения, 4-7.9 ч после в/в введения).

Общий клиренс составляет при в/м введении - 0.023 л/ч/кг (0.019 л/ч/кг у пожилых пациентов), при в/в введении - 0.03 л/ч/кг.

У пациентов с почечной недостаточностью при концентрации креатинина в плазме 19-50 мг/л общий клиренс составляет 0.015 л/ч/кг.

Фармакокинетика в особых клинических случаях

У пациентов с почечной недостаточностью V_d - 0.15-0.33 л/кг кеторолака может увеличиваться в 2 раза, а V_d его R-энантиомера - на 20%.

$T_{1/2}$ 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 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.

Не выводится при гемодиализе.

Показания к применению:

Болевой синдром сильной и умеренной выраженности:

— травмы;

— 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:

— полное или неполное сочетание бронхиальной астмы, рецидивирующего полипоза носа и околоносовых пазух и

непереносимости ацетилсалициловой кислоты или других НПВС (в т.ч. в анамнезе);

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

— непереносимость лекарственных средств пиразолонового ряда;

— гиповолемия (независимо от вызвавшей ее причины);

— эрозивно-язвенные поражения ЖКТ в фазе обострения;

— гипокоагуляция (в т.ч. гемофилия);

— кровотечения или высокий риск их развития;

— почечная недостаточность тяжелой степени (КК менее 30 мл/мин);

— тяжелая печеночная недостаточность или активное заболевание печени;

— состояние после проведения аортокоронарного шунтирования;

— подтвержденная гиперкалиемия;

— воспалительные заболевания кишечника;

— период родов;

— период лактации;

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

— повышенная чувствительность к компонентам препарата.

С *осторожностью:* бронхиальная астма; наличие факторов, повышающих токсическое действие на ЖКТ (алкоголизм, табакокурение и холецистит); послеоперационный период, хроническая сердечная недостаточность, отечный синдром, артериальная гипертензия, нарушение функции почек (креатинин сыворотки менее 50 мг/л), холестаз, сепсис, системная красная волчанка, одновременный прием с другими НПВС, ИБС, цереброваскулярные заболевания, дислипидемия/гиперлипидемия, сахарный диабет, заболевания периферических артерий, хроническая почечная недостаточность (КК 30-60 мл/мин), язвенные поражения ЖКТ в анамнезе, наличие инфекции Helicobacter pylori, длительное применение НПВС, тяжелые соматические заболевания, одновременный прием пероральных ГКС (в т.ч. преднизолона), антикоагулянтов (в т.ч. варфарина), антиагрегантов (в т.ч. клопидогрела), селективных ингибиторов обратного захвата серотонина (в т.ч. циталопрама, флуоксетина, пароксетина, сертралина), пациенты пожилого возраста (старше 65 лет).

Способ применения и дозы:

Препарат вводят в/м и в/в.

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

Пациентам в возрасте от 16 до 64 лет с массой тела более 50 кг при в/м введении разовая доза составляет не более 60 мг (с учетом перорального приема), обычно вводят по 30 мг каждые 6 ч. При в/в введении разовая доза составляет 30 мг (не более 15 доз за 5 сут). Максимальная суточная доза для в/м и в/в введения - 90 мг/сут.

Взрослым пациентам с массой тела менее 50 кг или с хронической почечной недостаточностью при в/м введении разовая доза составляет не более 30 мг (включая пероральную дозу), обычно - по 15 мг (не более 20 доз за 5 сут). При в/в введении разовая доза - не более 15 мг каждые 6 ч (не более 20 доз за 5 сут). Максимальная суточная доза для в/м и в/в введения составляет 60 мг.

Для **пациентов пожилого возраста (старше 65 лет)** максимальная суточная доза для в/м и в/в введения составляет 60 мг.

Максимальная длительность лечения - 5 сут.

Побочное действие:

Частота побочных эффектов: 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 одышка, ринит, отек легких, отек гортани (затруднение дыхания).

Со стороны нервной системы: 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 АД.

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

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

Со стороны кожных покровов: менее часто - кожная сыпь (включая макуло-папулезную 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).

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

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

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

Передозировка:

Симптомы: абдоминальные боли, тошнота, рвота, пептическая язва желудка, эрозивный гастрит, нарушение функции почек, метаболический ацидоз.

Лечение: симптоматическая терапия, поддержание жизненно важных функций организма. Не выводится в достаточной степени с помощью диализа.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Противопоказано применение при беременности и в период лактации.

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 язвенных поражений ЖКТ и развитию желудочно-кишечных кровотечений.

Совместное применение с парацетамолом повышает нефротоксичность.

При одновременном применении с метотрексатом возможно уменьшение клиренса метотрексата, усиливается его токсичность, а также гепато- и нефротоксичность. Одновременное назначение кеторолака и метотрексата возможно только при применении последнего в низких дозах (необходим контроль концентрации метотрексата в плазме крови).

Пробенецид уменьшает плазменный клиренс и V_d кеторолака, повышает его концентрацию в плазме крови и увеличивает $T_{1/2}$.

На фоне применения кеторолака возможно уменьшение клиренса лития и усиление его токсичности.

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

Кеторолак уменьшает эффективность гипотензивных и диуретических препаратов (снижается синтез простагландина в почках).

При комбинировании кеторолака с опиоидными анальгетиками дозы последних могут быть существенно уменьшены.

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

Совместное назначение с вальпроевой кислотой вызывает нарушение агрегации тромбоцитов.

Кеторолак повышает концентрацию в плазме крови верапамила и нифедипина.

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 крови.

Фармацевтическое взаимодействие

Раствор для инъекций не следует смешивать в одном шприце с морфином, прометазином и гидроксизином из-за выпадения осадка. Фармацевтически несовместим с раствором трамадола, препаратами лития.

Раствор Кеторолак Ромфарм не следует смешивать в одном шприце с другими лекарственными препаратами.

Особые указания и меры предосторожности:

Для снижения риска развития нежелательных реакций со стороны ЖКТ препарат следует применять в минимальной эффективной дозе минимально возможным коротким курсом.

Гиповолемия повышает риск развития побочных реакций со стороны почек.

При необходимости кеторолак можно назначать в комбинации с опиоидными анальгетиками.

Влияние на агрегацию тромбоцитов прекращается через 24-48 ч. Пациентам с нарушением свертывания крови препарат назначают только при постоянном контроле числа тромбоцитов; особенно это важно в послеоперационном периоде и требует тщательного контроля гемостаза.

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

Не применять одновременно с парацетамолом более 5 дней.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

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

При нарушениях функции почек

Противопоказания: почечная недостаточность тяжелой степени (КК менее 30 мл/мин).

С *осторожностью:* хроническая почечная недостаточность (КК 30-60 мл/мин), нарушение функции почек (креатинин сыворотки менее 50 мг/л),

При нарушениях функции печени

Противопоказания: тяжелая печеночная недостаточность или активное заболевание печени.

Применение в пожилом возрасте

С осторожностью у пациентов пожилого возраста (старше 65 лет).

Применение в детском возрасте

Противопоказан в детском и подростковом возрасте до 16 лет.

Условия хранения:

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

Срок годности:

3 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

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