

УТВЕРЖДЕНА
Приказом председателя
Комитета контроля медицинской и
фармацевтической деятельности
Министерства Здравоохранения
Республики Казахстан
от «___» _____ 201__ года
№ _____

**Инструкция по медицинскому применению
лекарственного средства**

Кеторол®

Торговое название

Кеторол®

Международное непатентованное название

Кеторолак

Лекарственная форма

Раствор для внутримышечного введения 30 мг/мл 1 мл

Состав

1 мл раствора содержит

активное вещество - кеторолак трометамин 30 мг

вспомогательные вещества: этанола 0.121 мл (эквивалентно этанолу безводному 0.115 мл), натрия хлорид, динатрия эдетат, октоксинол-9, натрия гидрохлорид, пропиленгликоль, вода для инъекций.

Описание

Прозрачная, бесцветная или светло-желтая жидкость

Фармакотерапевтическая группа

Нестероидные противовоспалительные препараты. Производные уксусной кислоты.

Код АТС M01AB15

Фармакологические свойства

Фармакокинетика

При парентеральном введении фармакокинетика кеторолака трометамин линейная. После внутримышечного введения 30 мг препарата его максимальная концентрация в плазме крови достигается через 50 минут. Биодоступность кеторола после внутримышечного введения составляет примерно 80 - 100%.

Кеторол® почти полностью связывается с белками плазмы (> 99%) за счет небольшого объема распределения (<0.3 л/кг). Почти все циркулирующее в

плазме крови вещество представляет собой кеторолак (96%) или его фармакологически неактивный метаболит *p*-гидроксикеторолак. Препарат проходит через плацентарный барьер на 10%. В малых концентрациях обнаружен в грудном молоке женщин. Через гематоэнцефалический барьер проходит плохо.

Препарат метаболизируется главным образом в печени, связываясь с глюкуроновой кислотой, и выводится почками. В моче обнаруживается до 92% от введенной дозы препарата, причем 40% - в виде метаболитов, 60% - в виде неизмененного вещества. Около 6% от введенной дозы выводится с калом. Метаболиты не имеют существенной анальгезирующей активности.

У больных старческого возраста (старше 65 лет) период полувыведения терминальной фазы, по сравнению с таковыми у лиц молодого возраста, увеличивается до 7 часов (от 4,3 до 8,6 часов). Общий плазменный клиренс по сравнению с лицами молодого возраста может быть снижен в среднем до 0,019 л/час/кг.

При поражении функции почек выведение кеторолака замедляется, о чем свидетельствует удлинение периода полувыведения и снижение общего плазменного клиренса по сравнению с молодыми здоровыми добровольцами. Скорость элиминации уменьшается примерно пропорционально степени нарушения функции почек, за исключением больных с тяжелым нарушением функции почек. У таких больных плазменный клиренс кеторолака становится несколько выше ожидаемого для данной степени поражения почек.

Фармакодинамика

Кеторол[®] – нестероидное противовоспалительное средство (НПВС), обладающее болеутоляющим, противовоспалительным действием и жаропонижающим действием. Основным механизмом действия кеторола проявляется в его фармакологическом эффекте - ингибировании синтеза простагландинов. НПВС наиболее активны на периферии.

Кеторол[®] не оказывает седативного или анксиолитического действия, не влияет на опиоидные рецепторы. Кеторол[®] не обладает угнетающим действием на дыхательный центр и не усиливает угнетение дыхания и седативный эффект, вызванные опиоидными анальгетиками. Кеторол[®] не вызывает лекарственной зависимости. После резкой отмены препарата симптомы отмены не возникают.

Показания к применению

- купирование болей в послеоперационном периоде (в том числе в стоматологии)
- купирование болей в мышцах и суставах
- посттравматический болевой синдром
- почечная колика

Способ применения и дозы

У больных моложе 65 лет однократная доза составляет 60 мг. Максимальная разовая доза – 60 мг. Максимальная суточная доза не должна превышать 120 мг. Терапия не должна превышать 5 дней.

У больных в возрасте 65 лет и старше, а также у больных с нарушенной функцией почек и/или с массой тела меньше 50 кг однократная рекомендованная доза составляет 30 мг. Максимальная суточная доза для этих больных не должна превышать 60 мг.

Болеутоляющий эффект начинается примерно через 30 минут, максимальный эффект достигает через 1 - 2 часа после внутримышечного введения. Продолжительность болеутоляющего эффекта составляет обычно 4 - 6 часов. Внутримышечные инъекции необходимо вводить медленно и глубоко в мышцу. Необходимо провести коррекцию гиповолемии до начала лечения кеторолом. Кеторол применяют для лечения выраженной острой боли, при которой необходимо обезболивание на уровне опиоидных препаратов, обычно в послеоперационном периоде.

Побочные действия

Часто (более 3%)

- головная боль, головокружение, сонливость
- отеки лица, голеней, лодыжек, пальцев, ступней
- увеличение массы тела
- боли и дискомфорт в области живота, анорексия, запор, диарея, диспепсия, отрыжка, метеоризм, тошнота, рвота, стоматит, эзофагит, обострение язвенной болезни желудка и двенадцатиперстной кишки

Менее часто (1 – 3%)

- кожная сыпь, пурпура
- жжение или боль в месте введения
- повышенная потливость

Редко (менее 1%)

- 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
- снижение слуха, звон в ушах, нарушение зрения
- бронхоспазм или диспноэ, ринит, отек гортани
- анемия, эозинофилия, лейкопения
- кровотечение из послеоперационной раны, носовое кровотечение, ректальное кровотечение, желудочно-кишечные кровотечения
- анафилаксия или анафилактоидные реакции (изменение цвета кожи лица, кожная сыпь, крапивница, зуд кожи, тахипноэ, отеки век, периорбитальный отек, одышка, затрудненное дыхание, тяжесть в грудной клетке, свистящее дыхание)
- асептический менингит (лихорадка, сильная головная боль, судороги, ригидность мышц шеи и / или спины), галлюцинации, депрессия, психоз

- 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
- отёк языка, лихорадка.

Противопоказания

- повышенная чувствительность к кеторолу, аспирину или к другим НПВС
- «аспириновая» астма, ангионевротический отек
- гиповолемия
- дегидратация
- эрозивно-язвенные поражения желудочно-кишечного тракта
- пептические язвы
- гипокоагуляция, в том числе гемофилия
- печеночная, почечная недостаточность
- геморрагический инсульт
- кровотечения, в том числе после операции
- нарушение кроветворения
- пред- и операционный период, из-за высокого риска кровотечения
- хронические боли
- беременность и период лактации
- детский и подростковый возраст до 16 лет

Лекарственные взаимодействия

Одновременное применение кеторола с ацетилсалициловой кислотой или другими НПВС, препаратами кальция, глюкокортикоидами, этанолом, кортикотропином может привести к образованию язв желудочно-кишечного тракта и развитию желудочно-кишечных кровотечений.

Совместное применение с парацетамолом повышает нефротоксичность, с метотрексатом – гепато- и нефротоксичность. Одновременное назначение кеторола и метотрексата возможно только при использовании низких доз последнего.

Пробенецид снижает плазменный клиренс и объем распределения кеторола, повышает его концентрацию в плазме крови и в 2 раза удлиняет период полувыведения. Одновременный прием кеторола и пробенецида противопоказан.

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

Повышается гипогликемическое действие инсулина и пероральных гипогликемических препаратов.

Совместное назначение с вальпроатом натрия вызывает нарушение агрегации тромбоцитов.

Кеторол® повышает концентрацию в плазме крови верапамила и нифедипина.

При назначении с другими нефротоксичными лекарственными средствами, в том числе с препаратами золота, повышается риск развития нефротоксичности.

Лекарственные средства, блокирующие канальцевую секрецию, снижают

клиренс кеторола и повышают его концентрацию в плазме крови.

Кеторол® незначительно снижает связывание варфарина с белками. При одновременном приеме с фуросемидом кеторол снижает мочегонное действие фуросемида примерно на 20%.

При одновременном приеме кеторола с препаратами лития увеличивается концентрация лития в плазме за счет ингибирования клиренса лития почками некоторыми НПВС.

При одновременном приеме кеторола и недеполяризирующих мышечных релаксантов у больных появляется одышка.

При приеме с противоэпилептическими препаратами (фенитоин, карбамазепин) усиливается частота приступов. При одновременном приеме с психотропными препаратами (флуоксетин, тиотиксин, алпразолам) у больных появляются галлюцинации.

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

Одновременное назначение кеторола и пентоксифиллина может усилить риск развития кровотечений.

При одновременном применении с фуросемидом кеторол уменьшает мочегонное действие фуросемида примерно на 20%, поэтому больным с сердечной недостаточностью препарат необходимо назначать с осторожностью. При одновременном применении с ингибиторами АПФ кеторол увеличивает риск нарушения функции почек.

Особые указания

Кеторол® нельзя вводить эпидурально и внутрь оболочек спинного мозга.

Поскольку НПВС снижают агрегацию тромбоцитов, необходимо назначать кеторол с осторожностью больным с нарушением свертывающей системы крови.

Применение у больных с нарушенной функцией печени

При приеме кеторола возможно повышение уровня печеночных трансаминаз. Кеторол® необходимо назначать коротким курсом лечения больным с заболеваниями печени.

Применение у больных с нарушенной функцией почек

Кеторол® назначается больным с нарушенной функцией почек с осторожностью под контролем анализов мочи.

Применение у больных пожилого возраста

При приеме кеторола побочные реакции у больных пожилого возраста встречаются чаще, необходимо назначение низких доз препарата. Максимальные дозы не должны превышать 60 мг для больных старше 65 лет.

Особенности влияния лекарственного средства на способность управлять транспортным средством или потенциально опасными механизмами

Поскольку у больных при назначении кеторола развиваются побочные явления со стороны центральной нервной системы (головокружение, сонливость) и со стороны органов чувств (снижение слуха, звон в ушах, нарушение зрения),

рекомендуется избегать выполнения работ, требующих повышенного внимания и быстрой реакции.

Передозировка

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

Лечение: промывание желудка, введение адсорбентов (уголь активированный), симптоматическое лечение.

Форма выпуска и упаковка

По 1 мл препарата разливают в ампулы из стекла янтарного цвета. На ампулу наклеивают этикетку из бумаги самоклеящейся.

По 10 ампул помещают в контурную ячейковую упаковку из пленки поливинилхлоридной и фольги алюминиевой печатной лакированной.

По 10 контурных ячейковых упаковок вместе с инструкцией по медицинскому применению на государственном и русском языках помещают в пачку из картона коробочного.

Условия хранения

Хранить в защищенном от света месте при температуре не выше 25 °С.
Хранить в местах, недоступных для детей!

Срок хранения

3 года.

По истечении срока годности не применять, указанного на упаковке.

Условия отпуска из аптек

По рецепту

Производитель

«Д-р Редди'с Лабораторис Лимитед»

7-1-27 Амерперт, Хайдерабад-500 016, Индия

Наименование владельца Регистрационного удостоверения:

«Д-р Редди'с Лабораторис Лимитед», Индия

Адрес организации, принимающей на территории Республики Казахстан претензии от потребителей по качеству продукции

Представительство компании «Д-р Редди'с Лабораторис Лимитед» в Республике Казахстан:

050057 г. Алматы, ул. 22 линия, 45

абонентский ящик 7,

тел: 8(727)3941688

факс: 8(727)3941294