ИНСТРУКЦИЯ

по медицинскому применению препарата

КЕТОЛАК®

Регистрационный номер:

Торговое название препарата: КЕТОЛАК®

Международное непатентованное название: Кеторолак.

Лекарственная форма: Таблетки, покрытые пленочной оболочкой.

Состав:
Одна таблетка содержит:
Активное вещество: кеторолака трометамол (кеторолака трометамин) – 0,010 г
Вспомогательные вещества: целлюлоза микрокристаллическая, сахар молочный (лактоза), магния стеарат, гидроксипропилметилцеллюлоза (гипромеллоза), двуокись титана пигментная (титана диоксид), макрогол 4000 – достаточное количество до получения таблетки, покрытой пленочной оболочкой, массой 0,205 г.

Описание:
Таблетки, покрытые пленочной оболочкой, круглые, двояковыпуклые, белого цвета.

Фармакотерапевтическая группа:
Нестероидный противовоспалительный препарат (НПВП).

Код АТХ: [M01AB15].

Фармакологическое действие:
НПВП, оказывает выраженное анальгезирующее действие, обладает также противовоспалительным и умеренным жаропонижающим действием. Механизм действия связан с неселективным угнетением активности ЦОГ1 и ЦОГ2, 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 соответственно через 0,5 - 1 ч, максимальный эффект достигается через 2-3 ч.

Фармакокинетика:
Абсорбция при приеме внутрь - быстрая, биодоступность - 80-100%. Cmax после перорального приема 10 мг - 0,7-1,1 мкг/мл, время достижения максимальной концентрации (TCmax) - 10-78 мин.
Равновесная концентрация (Css) достигается при пероральном введении - 24 ч при назначении 4 раза в сутки (выше субтерапевтической) и составляет после перорального приема 10 мг – 0,39-0,79мкг/мл. Связь с белками плазмы - 99%.
Объем распределения – 0,15-0,33 л/кг. У больных с почечной недостаточностью объем распределения препарата может увеличиваться в 2 раза, а объем распределения его R-энантиомера - на 20%.
Проникает в грудное молоко: при приеме матерью 10 мг кеторолака Cmax в 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 в сутки) – 7,9 нг/л.
Более 50% введенной дозы метаболизируется в печени с образованием фармакологически неактивных метаболитов. Главными метаболитами являются глюкурониды, которые выводятся почками, и р-гидроксикеторолак. Выводится на 91% почками, 6% - через кишечник.
Период полувыведения (T1/2) у пациентов с нормальной функцией почек – около 9 ч возрастает у пожилых пациентов и укорачивается у молодых. Функция печени не оказывает влияния на T1/2. У пациентов с нарушением функции почек при концентрации креатинина в плазме 19-50 мг/л (168-442 мкмоль/л) T1/2 – 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, зубная боль, боли в послеродовом и послеоперационном периоде, онкологические заболевания, миалгия, артралгия, невралгия, радикулит, вывихи, растяжения, ревматические заболевания. Предназначен для симтоматической терапии, уменьшения боли и воспаления на момент использования, на прогрессирование заболевания не влияет.

Противопоказания:
Гиперчувствительность к активному веществу или вспомогательным компонентам.

Анамнестические данные о приступе бронхообструкции, ринита, крапивницы после приема ацетилсалициловой кислоты или иного НПВП (полный или неполный синдром непереносимости ацетилсалициловой кислоты – риносинусит, крапивница, полипы слизистой носа, бронхиальная астма).

Эрозивно-язвенные поражения желудочно-кишечного тракта в стадии обострения, пептические язвы, кровотечения или высокий риск их развития, гипокоагуляция (в т.ч. гемофилия), воспалительные заболевания кишечника (болезнь Крона, неспецифический язвенный колит).

Выраженная печеночная недостаточность или активное заболевание печени.

Выраженная почечная недостаточность (клиренс креатинина менее 30 мл/мин), прогрессирующие заболевания почек.

Подтвержденная гиперкалиемия.

Декомпенсированная сердечная недостаточность.

Противопоказан в период после проведения аортокоронарного шунтирования.

Препарат не применяют для обезболивания перед и во время хирургических операций из-за высокого риска кровотечения.

III триместр беременности, роды и период лактации (следует отказаться от кормления на период применения препарата).

Детский возраст до 16 лет (эффективность и безопасность не установлены).

С осторожностью:
Бронхиальная астма, наличие факторов, повышающих токсичность в отношении ЖКТ: алкоголизм и холецистит; хроническая сердечная недостаточность, отечный синдром, артериальная гипертензия, нарушение функции почек, холестаз, активный гепатит, сепсис, одновременный прием с другими НПВП, пожилой возраст (старше 65 лет), беременность (I-II триместр).
Ишемическая болезнь сердца, цереброваскулярные заболевания, застойная сердечная недостаточность, дислипидемия/гиперлипидемия, сахарный диабет, заболевания периферических артерий, курение, клиренс креатинина менее 60 мл/мин.

Анамнестические данные о развитии язвенного поражения ЖКТ, наличие инфекции Helicobacter pylori, длительное использование НПВП, тяжелые соматические заболевания, сопутствующая терапия следующими препаратами:

- антикоагулянты (например, варфарин)

- антиагреганты (например, ацетилсалициловая кислота, клопидогрель)

- пероральные глюкокортикостероиды (например, преднизолон)

- селективные ингибиторы обратного захвата серотонина (например, циталопрам, флуоксетин, пароксетин, сертралин)

Для снижения риска развития нежелательных явлений со стороны ЖКТ следует использовать минимальную эффективную дозу минимально возможным коротким курсом.

Применение во время беременности и в период лактации. Проникает в грудное молоко в незначительных количествах. Применение при III триместре беременности и кормлении грудью противопоказано (следует отказаться от кормления на период применения препарата); в крайних случаях при необходимости использования препарата во время беременности следует сопоставить пользу для матери и риск для плода или ребенка.

Способ применения и дозы: Внутрь, в виде таблеток КЕТОЛАК® применяют однократно или повторно в зависимости от тяжести болевого синдрома.

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 в сутки, но не более 40 мг/сут.
Взрослым пациентам с массой тела менее 50 кг, пациентам старше 64 лет или с почечной недостаточностью - 10 мг в первый прием и далее по 10 мг 4 раза в сутки.
Максимальная суточная доза при пероральном применении составляет 40 мг.
При приеме внутрь продолжительность курса не должна превышать 5 дней.

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 и др.), холестатическая желтуха, гепатит, гепатомегалия, острый панкреатит.
Со стороны мочевыделительной системы: редко - острая почечная недостаточность, боль в пояснице, гематурия, азотемия, гемолитикоуремический 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 центральной 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, обморочные состояния.
Со стороны сердечно-сосудистой системы: менее часто - повышение артериального давления.
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, 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 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.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:
Совместное назначение с парацетамолом повышает нефротоксичность кеторолака.
Прием с др. НПВП, глюкокортикостероидами, 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 их назначение возможно только при использовании низких доз последнего и контроле его концентрации в плазме).
При назначении с др. 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 наркотических анальгетиков.
Миелотоксические лекарственные средства - усиление гематотоксичности препарата.

Особые указания: Гиповолемия повышает риск развития нефротоксических побочных реакций.
При необходимости можно назначать в комбинации с наркотическими анальгетиками.
Не рекомендуется применять в качестве лекарственного средства для премедикации, поддержания анестезии.
При совместном приеме с др. НПВП могут наблюдаться задержка жидкости, декомпенсация сердечной деятельности, повышение артериального давления. 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.
В период лечения необходимо соблюдать осторожность при вождении автотранспорта и занятии др. потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций.

Форма выпуска: Таблетки, покрытые пленочной оболочкой, по 10 мг.

По 20 таблеток в банки из стекломассы или полимерные; по 10 таблеток в контурные безъячейковые или контурные ячейковые упаковки.

Каждую банку или 2 контурные упаковки вместе с инструкцией по применению в пачку.

Условия хранения: Список Б.

В сухом, защищенном от света месте, при температуре не выше 30 °С.

Хранить в недоступном для детей месте!

Срок годности: 2 года.
Не использовать по истечении срока годности, указанного на упаковке.

Условия отпуска из аптек: По рецепту.

Производитель/организация, принимающая претензии:
ЗАО «Алтайвитамины»
659325, Россия, Алтайский край, г. Бийск, ул. Заводская, 69
Телефон: (3854) 32-69-43, 32-69-46
Факс: (3854) 32-71-53, 32-76-40
E-mail: texotdel@altayvitamin.ru

Федеральное государственное учреждение «Центр экспертизы средств медицинского применения Росздравнадзора» Институт доклинической и клинической экспертизы лекарственных средств для выпуска инструкций МОСКВА

И.о. директора ИДКЭЛС А.Н. Васильев

Генеральный директор
ЗАО «Алтайвитамины» Ю.А. Кошелев

Закрытое акционерное общество «Алтайвитамины» РОССИЯ Алтайский край г. Бийск