ИНСТРУКЦИЯ

по медицинскому применению препарата

АДОЛОР

Регистрационный номер: ЛС-000344

Торговое название препарата: АДОЛОР

Международное непатентованное название: кеторолак

Лекарственная форма: таблетки, покрытые оболочкой

Состав
Активное вещество: кеторолака трометамин 0,01 г
Вспомогательные вещества: сахар молочный (лактоза), целлюлоза микрокристаллическая, магния стеарат, гидроксипропилметилцеллюлоза 15 СР, полиэтиленгликоль 6000 , титана диоксид

Описание

Таблетки покрытые оболочкой белого или белого с кремоватым оттенком цвета, круглые двояковыпуклой формы. На поперечном разрезе видны два слоя.

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 др. 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% . Максимальная концентрация (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 через 24 ч при назначении 4 раза в сутки (выше субтерапевтической) и составляет после перорального приема 10 мг - 0.39-0.79 мкг/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, боли в послеродовом и послеоперационном периоде, онкологические заболевания, миалгия, артралгия, невралгия, радикулит.

Противопоказания. Гиперчувствительность, "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 желудочно-кишечного тракта 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

ЗАО "ОБОЛЕНСКОЕ" ФАРМАЦЕВТИЧЕСКОЕ ПРЕДПРИЯТИЕ ИНН 5077009710

родов, период лактации, детский возраст (до 16 лет - безопасность и эффективность не установлены).

С осторожностью. Гиперчувствительность к др. НПВП, бронхиальная астма, наличие факторов, повышающих токсичность в отношении желудочно-кишечного тракта: 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 др. НПВП, пожилой возраст (старше 65 лет), беременность.

Применение во время беременности и в период лактации. Проникает в грудное молоко в незначительных количествах. Применение при III триместре беременности и кормлении грудью противопоказано; в крайних ситуациях следует сопоставлять пользу для матери и риск для плода или ребенка.

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 в сутки, 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 в сутки.

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 желудочно-кишечного тракта (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, 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).

ЗАО ЗАКРЫТОЕ АКЦИОНЕРНОЕ ОБЩЕСТВО "ОБОЛЕНСКОЕ" ФАРМАЦЕВТИЧЕСКОЕ ПРЕДПРИЯТИЕ "ОБОЛЕНСКОЕ" ОГРН 1025007774690 ИНН 5077009710

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 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 желудочно-кишечного тракта, нарушение функции почек, метаболический ацидоз.

Лечение: симптоматическое (поддержание жизненно важных функций организма). Диализ - малоэффективен.

Лекарственное взаимодействие.

Совместное назначение с парацетамолом повышает нефротоксичность кеторолака.

Прием с др. НПВП, глюкокортикостероидами, этанолом, кортикотропином, препаратами кальция увеличивает риск изъязвления слизистой оболочки желудочно-кишечного тракта 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).

ЗАО "ОБОЛЕНСКОЕ" * ОГРН 1035077748901 * ИНН 5077009710

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.

Миелотоксичные лекарственные средства - усиление гематотоксичности.

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 может 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:

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

По 1 или 2 контурных ячейковых упаковки вместе с инструкцией по применению вложены в пачку из картона.

Условия хранения. Список Б.

Таблетки, покрытые оболочкой по 10 мг 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 из аптек: по рецепту.

Предприятие изготовитель:
ЗАО «Фармацевтическое предприятие «Оболенское», 142279, Московская обл., п.Оболенск, ГНЦ ПМ, корп.7/8,
Тел./факс (0967) 36-01-07

Директор ИДКЭЛС, профессор В.В. Чельцов

Директор Е.В. Зимин